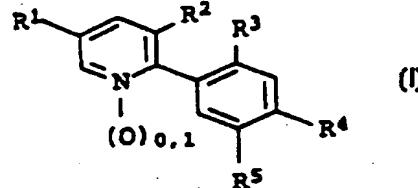


PCT
WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM
Internationales Büro
INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICH NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)



(51) Internationale Patentklassifikation ⁶ : C07D 213/70, 213/71, A01N 43/40, C07D 213/61, 213/73		A1	(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 98/07700 (43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 26. Februar 1998 (26.02.98)
(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP97/04420 (22) Internationales Anmeldedatum: 13. August 1997 (13.08.97)		(74) Gemeinsamer Vertreter: BASF AKTIENGESELLSCHAFT; D-67056 Ludwigshafen (DE).	
(30) Prioritätsdaten: 196 33 746.1 22. August 1996 (22.08.96) DE		(81) Bestimmungsstaaten: AL, AU, BG, BR, BY, CA, CN, CZ, GE, HU, IL, JP, KE, KR, KZ, LT, LV, MX, NO, NZ, PL, RO, RU, SG, SI, SK, TR, UA, US, UZ, VN, ARIPO Patent (GH, KE, LS, MW, SD, SZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).	
(71) Anmelder (<i>für alle Bestimmungsstaaten ausser US</i>): BASF AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-67056 Ludwigshafen (DE).		Veröffentlicht <i>Mit internationalem Recherchenbericht. Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche zugelassenen Frist. Veröffentlichung wird wiederholt falls Änderungen eintreffen.</i>	
(72) Erfinder; und (75) Erfinder/Anmelder (<i>nur für US</i>): SCHÄFER, Peter [DE/DE]; Römerstrasse 1, D-67308 Ottersheim (DE). RACK, Michael [DE/DE]; Sandwinger 67, D-69123 Heidelberg (DE). HAMPRECHT, Gerhard [DE/DE]; Rote-Turm-Strasse 28, D-69469 Weinheim (DE). WALTER, Helmut [DE/DE]; Grünstadter Strasse 82, D-67283 Obrigheim (DE). WEST-PHALEN, Karl-Otto [DE/DE]; Mausbergweg 58, D-67346 Speyer (DE). MISSLITZ, Ulf [DE/DE]; Am Herz 40, D-67433 Neustadt (DE). MENGES, Markus [DE/DE]; Berliner Strasse 22, D-68161 Mannheim (DE). ZAGAR, Cyril [DE/DE]; Georg-Herwegh-Strasse 31, D-67061 Ludwigshafen (DE). MENKE, Olaf [DE/DE]; Lerchenweg 3, D-67317 Altleiningen (DE).			
(54) Title: SUBSTITUTED 2-PHENYL PYRIDINE AS HERBICIDE			
(54) Bezeichnung: SUBSTITUIERTE 2-PHENYL PYRIDINE ALS HERBIZIDE			
(57) Abstract			
<p>The present invention pertains to substituted 2-phenylpyridine I and the salts thereof of formula (I), where R¹ = SH, SO₂NH₂, C₁-C₆-alkylthio, C₁-C₆-alkyl-sulfinyl, C₁-C₆-alkylsulfonyl, C₁-C₆-alkylaminosulfonyl, Di-(C₁-C₆-alkyl)aminosulfonyl; R¹, R³ = H, halogen; R⁴ = CN, OH, halogen, C₁-C₆-alkoxy, possibly substituted OCH₂-phenyl and R⁵ have the meanings given in the description. The invention also relates to: the use of compounds (I) as herbicides or as plant dessicating/defoliating agents, the herbicides and the plant dessicating/defoliating agents containing compounds (I) as actives substances, the processes for controlling undesirable plant growth and for dessicating/defoliating plants using compounds (I), the processes for producing compounds (I), herbicides and plant dessicating/defoliating agents by compounds (I), as well as the intermediate products of formulae (IIa, V and VI).</p>			
(57) Zusammenfassung			
<p>Substituierte 2-Phenylpyridine (I) und deren Salze, wobei R¹ = SH, SO₂OH, SO₂Cl, SO₂NH₂, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkyl-sulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Alkylaminosulfonyl, Di-(C₁-C₆-alkyl)aminosulfonyl; R², R³ = H, Halogen; R⁴ = CN, OH, Halogen, C₁-C₆-Alkoxy, geg. subst. OCH₂-Phenyl; und R⁵ die in Anspruch I angegebenen Bedeutungen hat. Außerdem betrifft die Erfindung die Verwendung der Verbindungen (I) als Herbizide oder zur Desikkation/Defoliation von Pflanzen, herbizide Mittel und Mittel zur Desikkation und/oder Defoliation von Pflanzen, welche die Verbindungen (I) als wirksame Substanzen enthalten. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs und zur Desikkation und/oder Defoliation von Pflanzen mit den Verbindungen (I), Verfahren zur Herstellung der Verbindungen (I) und von herbiziden Mitteln und Mitteln zur Desikkation und/oder Defoliation von Pflanzen unter Verwendung der Verbindungen (I) sowie Zwischenprodukte der Formeln (IIa, V und VI).</p>			



LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

AL	Albanien	ES	Spanien	LS	Lesotho	SI	Slowenien
AM	Armenien	FI	Finnland	LT	Litauen	SK	Slowakei
AT	Osternreich	FR	Frankreich	LU	Luxemburg	SN	Senegal
AU	Australien	GA	Gabun	LV	Lettland	SZ	Swasiland
AZ	Aserbaidschan	GB	Vereinigtes Königreich	MC	Monaco	TD	Tschad
BA	Bosnien-Herzegowina	GE	Georgien	MD	Republik Moldau	TC	Togo
BB	Barbados	GH	Ghana	MG	Madagaskar	TJ	Tadschikistan
BE	Belgien	GN	Guinea	MK	Die ehemalige jugoslawische Republik Mazedonien	TM	Turkmenistan
BF	Burkina Faso	GR	Griechenland	ML	Mali	TR	Türkei
BG	Bulgarien	HU	Ungarn	MN	Mongolei	TT	Trinidad und Tobago
BJ	Benin	IR	Irland	MR	Mauretanien	UA	Ukraine
BR	Brasilien	IL	Israel	MW	Malawi	UG	Uganda
BY	Belarus	IS	Island	MX	Mexiko	US	Vereinigte Staaten von Amerika
CA	Kanada	IT	Italien	NK	Niger	UZ	Usbekistan
CF	Zentralafrikanische Republik	JP	Japan	NL	Niederlande	VN	Vietnam
CG	Kongo	KE	Kenia	NO	Norwegen	YU	Jugoslawien
CH	Schweiz	KG	Kirgisistan	NZ	Neuseeland	ZW	Zimbabwe
CI	Côte d'Ivoire	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	PL	Polen		
CM	Kamerun	KR	Republik Korea	PT	Portugal		
CN	China	KZ	Kasachstan	RO	Rumänien		
CU	Kuba	LC	St. Lucia	RU	Russische Föderation		
CZ	Tschechische Republik	LI	Liechtenstein	SD	Sudan		
DE	Deutschland	LK	Sri Lanka	SE	Schweden		
DK	Dänemark	LR	Liberia	SG	Singapur		
EE	Estonia						

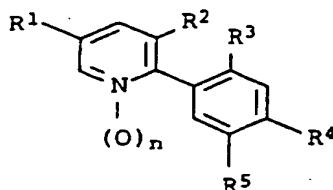
SUBSTITUIERTE 2-PHENYL PYRIDINE ALS HERBIZIDE

Beschreibung

5

Die vorliegende Erfindung betrifft neue substituierte 2-Phenyl-pyridine der Formel I

10



I,

15 in der die Variablen folgende Bedeutungen haben:

n Null oder 1;

R¹ Mercapto, Hydroxysulfonyl, Chlorsulfonyl, Aminosulfonyl,

20 C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Alkylaminosulfonyl oder Di-(C₁-C₆-alkyl)aminosulfonyl;

R², R³ unabhängig voneinander Wasserstoff oder Halogen;

25 R⁴ Cyano, Hydroxy, Halogen, C₁-C₆-Alkoxy oder Phenylmethoxy, wobei der Phenytring unsubstituiert sein oder ein bis drei Substituenten tragen kann, jeweils ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Hydroxy, Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy,

30 Hydroxycarbonyl, (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl und (C₁-C₆-Alkoxy)-carbonyl-C₁-C₆-alkoxy;

R⁵ Wasserstoff, Nitro, Cyano, Hydroxylamino, Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, -COCl, -CO-OR⁶,

35 -CO-N(R⁷)R⁸, -CO-O-(C₁-C₄-Alkylen)-CO-OR⁶, -CO-O-(C₁-C₄-Alkylen)-CO-N(R⁷)R⁸, -X¹-(C₁-C₄-Alkylen)-CO-R⁶,

-X¹-(C₁-C₄-Alkylen)-CO-OR⁶,

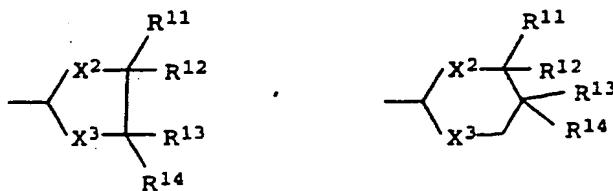
-X¹-(C₁-C₄-Alkylen)-CO-O-(C₁-C₄-Alkylen)-CO-OR⁶,

-X¹-(C₁-C₄-Alkylen)-CO-N(R⁷)R⁸, -X¹-R⁹, -CH=C(R¹⁰)-CO-OR⁶,

40 -CH=C(R¹⁰)-CO-O-(C₁-C₄-Alkylen)-CO-OR⁶,

-CH=C(R¹⁰)-CO-N(R⁷)R⁸, Formyl, -CO-R⁶,

45



WO 98/07700

-C(R⁸)=N-OR¹⁵, -X¹-(C₁-C₄-Alkylen)-C(R⁸)=N-OR¹⁵,
 -CH=C(R¹⁰)-C(R⁸)=N-OR¹⁵, -CH(C₁-C₆-Alkoxy)₂, -N(R¹⁶)R¹⁷,
 -N(R¹⁶)-SO₂-(C₁-C₆-Alkyl), -N(R¹⁶)-CO-(C₁-C₆-Alkyl),
 Chlorsulfonyl, Hydroxysulfonyl oder -SO₂-N(R¹⁸)R¹⁹;

5

R⁶ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₆-Alkenyl,
 C₃-C₆-Alkinyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl
 oder 3-Oxetanyl;

10 R⁷ Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl;

R⁸ Wasserstoff, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, Hydroxycarbonyl-C₁-C₆-
 alkyl, (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkoxy,
 C₁-C₆-Halogenalkoxy, Phenyl-C₁-C₆-alkoxy, C₃-C₆-Alkenyloxy
 15 oder C₃-C₆-Alkinyloxy oder

R⁷ und R⁸ zusammen eine Tetra- oder Pentamethylenkette, die einen
 (C₁-C₆-Alkoxy)carbonylrest tragen kann;

20 R⁹ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₆-Alkenyl,
 C₃-C₆-Alkinyl, C₃-C₆-Cycloalkyl oder C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-
 alkyl;

R¹⁰ Wasserstoff, Halogen oder C₁-C₆-Alkyl;

25 R¹¹-R¹⁴ unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl oder
 (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl;

R¹⁵ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, Phenyl-C₁-C₆-alkyl,
 30 (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₆-alkyl, C₃-C₆-Alkenyl
 oder C₃-C₆-Alkinyl;

R¹⁶ Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl;

35 R¹⁷ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, Hydroxycarbonyl-C₁-C₆-alkyl,
 (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₆-alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy;

R¹⁸ Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl;

40 R¹⁹ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, Hydroxycarbonyl-C₁-C₆-alkyl,
 (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₆-alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy oder

R¹⁸ und R¹⁹ zusammen eine Tetra- oder Pentamethylenkette,
 die einen (C₁-C₆-Alkoxy)carbonylrest tragen kann;

45

X¹-X³ unabhängig voneinander Sauerstoff oder Schwefel,

sowie die landwirtschaftlich brauchbaren Salze der Verbindungen I mit R⁶ = Wasserstoff.

Außerdem betrifft die Erfindung

- 5 - die Verwendung der Verbindungen I als Herbizide oder zur Desikkation/Defoliation von Pflanzen,
- herbizide Mittel und Mittel zur Desikkation und/oder Defoliation von Pflanzen, welche die Verbindungen I als wirksame Substanzen enthalten,
- 10 - Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs und zur Desikkation und/oder Defoliation von Pflanzen mit den Verbindungen I,
- Verfahren zur Herstellung der Verbindungen I und von herbiziden Mitteln und Mitteln zur Desikkation und/oder
- 15 - Defoliation von Pflanzen unter Verwendung der Verbindungen I sowie
- Zwischenprodukte der Formeln IIa, V und VI.

In der WO 95/02580 wird eine Vielzahl von herbidzid wirksamen 20 2-Phenylpyridinen beschrieben. Unter die dortige allgemeine Formel fallen auch einige der vorliegenden Verbindungen I mit R¹ = C₁-C₄-Alkylthio.

Gegenstand der WO 94/05153 sind herbizid wirksame Benzolverbindungen, die u.a. auch einen durch Halogen und Methylthio substituierten Pyridinring tragen können. Das spezielle Substitutionsmuster der vorliegenden 2-Phenylpyridine ist dieser Druckschrift jedoch nicht zu entnehmen.

30 In DE-A 19 500 760, DE-A 19 500 758 und DE-A 19 500 911 werden bereits bestimmte substituierte 2-Phenylpyridine vom Typ der Verbindungen I mit Mercapto, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl in 5-Position des Pyridinringes als herbizide und desikkante/defoliante Wirkstoffe beschrieben.

35 Die herbizide Wirkung der bekannten Verbindungen bezüglich der Schadpflanzen ist jedoch nicht immer voll befriedigend. Aufgabe der vorliegenden Erfindung war es demnach, neue herbizid wirksame Verbindungen bereitzustellen, mit denen sich unerwünschte 40 Pflanzen besser als bisher gezielt bekämpfen lassen. Die Aufgabe erstreckt sich auch auf die Bereitstellung neuer desikkant/defoliant wirksamer Verbindungen.

Demgemäß wurden die eingangs definierten substituierten 2-Phenylpyridine der Formel I mit herbizider Wirkung sowie neue Zwischenprodukte V und VI zu deren Herstellung gefunden.

Ferner wurden herbizide Mittel gefunden, die die Verbindungen I enthalten und eine sehr gute herbizide Wirkung besitzen. Außerdem wurden Verfahren zur Herstellung dieser Mittel und Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs mit den Verbindungen I 5 gefunden.

Des weiteren wurde gefunden, daß die Verbindungen I auch zur Defoliation/Desikkation von Pflanzenteilen geeignet sind, wofür Kulturpflanzen wie Baumwolle, Kartoffel, Raps, Sonnenblume, Soja- 10 bohne oder Ackerbohnen, insbesondere Baumwolle und Kartoffel, in Betracht kommen. Diesbezüglich wurden Mittel zur Desikkation und/ oder Defoliation von Pflanzen, Verfahren zur Herstellung dieser Mittel und Verfahren zur Desikkation und/oder Defoliation von Pflanzen mit den Verbindungen I gefunden.

15 Die Verbindungen der Formel I können je nach Substitutionsmuster ein oder mehrere Chiralitätszentren enthalten und liegen dann als Enantiomeren- oder Diastereomerengemische vor. Gegenstand der Erfindung sind sowohl die reinen Enantiomere oder Diastereomere 20 als auch deren Gemische.

Die substituierten 2-Phenylpyridine I mit R⁶ = Wasserstoff können in Form ihrer landwirtschaftlich brauchbaren Salze vorliegen, wobei es auf die Art des Salzes in der Regel nicht ankommt. Im 25 allgemeinen kommen die Salze von solchen Basen in Betracht, bei denen die herbizide Wirkung im Vergleich zu der freien Verbindung I nicht negativ beeinträchtigt ist.

Als Salze eignen sich besonders diejenigen der Alkalimetalle, 30 vorzugsweise Natrium- und Kaliumsalze, der Erdalkalimetalle, vorzugsweise Calcium- und Magnesiumsalze, die der Übergangs- metalle, vorzugsweise Zink- und Eisensalze, sowie Ammoniumsalze, bei denen das Ammoniumion gewünschtenfalls ein bis vier C₁-C₄-Alkyl-, Hydroxy-C₁-C₄-alkylsubstituenten und/oder einen 35 Phenyl- oder Benzylsubstituenten tragen kann, vorzugsweise Diisopropylammonium-, Tetramethylammonium-, Tetrabutylammonium-, Trimethylbenzylammonium- und Trimethyl-(2-hydroxyethyl)-ammonium- salze, des weiteren Phosphoniumsalze, Sulfoniumsalze wie vorzugs- weise Tri-(C₁-C₄-alkyl)sulfonium-salze, und Sulfoxoniumsalze wie 40 vorzugsweise Tri-(C₁-C₄-alkyl)sulfoxoniumsalze.

Die für die Substituenten R¹ und R⁴ bis R¹⁹ oder als Reste an einem Phenylring oder an Tetra- oder Pentamethylen genannten organischen Molekülteile stellen Sammelbegriffe für individuelle 45 Aufzählungen der einzelnen Gruppenmitglieder dar. Sämtliche Kohlenstoffketten, also alle Alkyl-, Halogenalkyl-, Phenylalkyl-, Alkylen-, Alkoxy-, Halogenalkoxy-, Phenylalkoxy-, Alkylthio-,

Alkylsulfinyl-, Alkylsulfonyl-, Hydroxycarbonylalkyl-, Alkoxy-carbonyl-, Alkylamino-, Alkenyl-, Alkinyl-, Alkenyloxy- und Alkinyloxy-Teile können geradkettig oder verzweigt sein.
Halogenierte Substituenten tragen vorzugsweise ein bis fünf
5 gleiche oder verschiedene Halogenatome.

Die Bedeutung Halogen steht jeweils für Fluor, Chlor, Brom oder Iod, insbesondere für Fluor oder Chlor.

10 Ferner stehen beispielsweise:

- C₁-C₆-Alkyl für: C₁-C₄-Alkyl wie CH₃, C₂H₅, n-Propyl, CH(CH₃)₂, n-Butyl, CH(CH₃)-C₂H₅, CH₂-CH(CH₃)₂ und C(CH₃)₃, oder z.B. n-Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl,
- 15 2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, n-Hexyl, 1,1-Dimethyl-propyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Di-methylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Di-methylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl,
- 20 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl oder 1-Ethyl-2-methylpropyl, insbesondere für CH₃, C₂H₅, n-Propyl, CH(CH₃)₂, n-Butyl, C(CH₃)₃, n-Pentyl oder n-Hexyl;
- 25 - C₁-C₆-Halogenalkyl für: einen C₁-C₆-Alkylrest wie vorstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. CH₂F, CHF₂, CF₃, CH₂Cl, CH(Cl)₂, C(Cl)₃, CHFCl, CF(Cl)₂, CF₂Cl, CF₂Br, 1-Fluor-ethyl, 2-Fluorethyl, 2-Chlorethyl, 2-Bromethyl, 2-Iodethyl,
- 30 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 1,2-Di-chlorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, C₂F₅, 2-Fluorpropyl, 3-Fluo-ropyl, 2,2-Difluorpropyl, 2,3-Difluorpropyl, 2-Chlorpropyl, 3-Chlorpropyl, 2,3-Dichlorpropyl, 2-Brompropyl, 3-Brompropyl,
- 35 3,3,3-Trifluorpropyl, 3,3,3-Trichlorpropyl, 2,2,3,3,3-Penta-fluorpropyl, CF₂-C₂F₅, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethyl, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethyl, 1-(Brommethyl)-2-bromethyl, 4-Fluorbutyl, 4-Chlorbutyl, 4-Brombutyl, Nonafluorbutyl, 5-Fluorpentyl, 5-Chlorpentyl, 5-Brompentyl, 5-Iopentyl,
- 40 5,5,5-Trichlorpentyl, Undecafluorpentyl, 6-Fluorhexyl, 6-Chlorhexyl, 6-Bromhexyl, 6-Iodhexyl, 6,6,6-Trichlorhexyl oder Dodecafluorhexyl, insbesondere für CH₂F, CHF₂, CF₃, CH₂Cl, 2-Fluorethyl, 2-Chlorethyl, 1,2-Dichlorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl oder C₂F₅;

45

- Phenyl-C₁-C₆-alkyl für: z.B. Benzyl, 1-Phenylethyl, 2-Phenyl-ethyl, 1-Phenylprop-1-yl, 2-Phenylprop-1-yl, 3-Phenylprop-1-yl, 1-Phenylbut-1-yl, 2-Phenylbut-1-yl, 3-Phenylbut-1-yl, 4-Phenylbut-1-yl, 1-Phenylbut-2-yl, 2-Phenylbut-2-yl,
5 3-Phenylbut-2-yl, 4-Phenylbut-2-yl, 1-(Benzyl)-eth-1-yl, 1-(Benzyl)-prop-1-yl oder 2-Phenyl-hex-6-yl, insbesondere für Benzyl oder 2-Phenyl-ethyl;

- 10 - C₃-C₆-Cycloalkyl für: Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl, insbesondere für Cyclopentyl oder Cyclohexyl;

- C₁-C₄-Alkylen für: -CH₂-, -CH(CH₃)-, 1,2-Ethylen,
15 1,1-Propylen, 1,2-Propylen, 1,3-Propylen, -C(CH₃)₂-, 1,1-Butylen, 1,2-Butylen, 1,3-Butylen, 1,4-Butylen, 2,2-Butylen, 2,3-Butylen, 2-Methyl-1,1-propylen, 2-Methyl-1,2-propylen oder 2-Methyl-1,3-propylen, vorzugsweise für Methylen, 1,1-Ethylen, 1,2-Ethylen,
20 1,1-Propylen oder 2,2-Propylen;

- C₁-C₆-Alkoxy für: z.B. OCH₃, OC₂H₅, n-Propoxy, OCH(CH₃)₂, n-Butoxy, OCH(CH₃)-C₂H₅, OCH₂-CH(CH₃)₂, OC(CH₃)₃, n-Pentoxy, 1-Methylbutoxy, 2-Methylbutoxy, 3-Methylbutoxy, 1,1-Dimethyl-
25 propoxy, 1,2-Dimethylpropoxy, 2,2-Dimethylpropoxy, 1-Ethyl-propoxy, n-Hexoxy, 1-Methylpentoxy, 2-Methylpentoxy, 3-Methylpentoxy, 4-Methylpentoxy, 1,1-Dimethylbutoxy, 1,2-Dimethylbutoxy, 1,3-Dimethylbutoxy, 2,2-Dimethylbutoxy, 2,3-Dimethylbutoxy, 3,3-Dimethylbutoxy, 1-Ethylbutoxy,
30 2-Ethylbutoxy, 1,1,2-Trimethylpropoxy, 1,2,2-Trimethylpropoxy, 1-Ethyl-1-methylpropoxy oder 1-Ethyl-2-methylpropoxy, insbesondere OCH₃, OC₂H₅, OCH(CH₃)₂ oder OC(CH₃)₃;

- C₁-C₆-Halogenalkoxy für: C₁-C₆-Alkoxy wie vorstehend genannt, das partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. OCH₂F, OCHF₂, OCF₃, OCH₂Cl, OCH(Cl)₂, OC(Cl)₃, OCHFCl, OCF(Cl)₂, OCF₂Cl, OCF₂Br, 1-Fluorethoxy, 2-Fluorethoxy, 2-Bromethoxy, 2-Iodethoxy, 2,2-Difluorethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-2-fluoroethoxy, 2-Chlor-2,2-difluorethoxy, 2,2-Dichlor-2-fluorethoxy, 2,2,2-Trichlorethoxy, OC₂F₅, 2-Fluorpropoxy, 3-Fluorpropoxy, 2-Chlorpropoxy, 3-Chlorpropoxy, 2-Brompropoxy, 3-Brompropoxy, 2,2-Difluorpropoxy, 2,3-Difluorpropoxy, 2,3-Dichlorpropoxy, 3,3,3-Trifluorpropoxy, 3,3,3-Trichlorpropoxy,
40 2,2,3,3,3-Pentafluorpropoxy, OCF₂-C₂F₅, 1-(CH₂F)-2-fluoroethoxy, 1-(CH₂Cl)-2-chlorethoxy, 1-(CH₂Br)-2-bromethoxy, 4-Fluorbutoxy, 4-Chlorbutoxy, 4-Brombutoxy, Nonafluorbutoxy,
45

5-Fluorpentoxyl, 5-Chlorpentoxyl, 5-Brompentoxyl, 5-Iodpentoxyl,
Undecafluorpentoxyl, 6-Fluorhexoxy, 6-Chlorhexoxy, 6-Brom-
hexoxy oder Dodecafluorhexoxy;

- 5 - Phenyl-C₁-C₆-alkoxy für: z.B. Benzyloxy, 1-Phenylethoxy,
2-Phenylethoxy, 1-Phenylprop-1-yloxy, 2-Phenylprop-1-yloxy,
3-Phenylprop-1-yloxy, 1-Phenylbut-1-yloxy, 2-Phenylbut-1-yloxy,
3-Phenylbut-1-yloxy, 4-Phenylbut-1-yloxy, 1-Phenylbut-
2-yloxy, 2-Phenylbut-2-yloxy, 3-Phenylbut-2-yloxy, 4-Phenyl-
but-2-yloxy, 1-(Benzyl)-eth-1-yloxy, 1-(Benzyl)-1-(methyl)-
eth-1-yloxy, 1-(Benzyl)-prop-1-yloxy oder 2-Phenyl-hex-6-yloxy,
insbesondere für Benzyloxy oder 2-Phenylethoxy;
- C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl für: durch C₁-C₆-Alkoxy wie vor-
15 stehend genannt substituiertes C₁-C₆-Alkyl, also z.B. für
CH₂OCH₃, CH₂OC₂H₅, CH₂OCH₂-C₂H₅, CH₂OCH(CH₃)₂, CH₂OCH₂CH₂-C₂H₅,
(1-Methylpropoxy)methyl, (2-Methylpropoxy)methyl, CH₂OC(CH₃)₃,
CH₂O(CH₂)₃-C₂H₅, CH₂O(CH₂)₄-C₂H₅, CH(CH₃)OCH₃, CH(CH₃)OC₂H₅,
CH₂CH₂OCH₃, CH₂CH₂OC₂H₅, CH₂CH₂OCH₂-C₂H₅, CH₂CH₂OCH(CH₃)₂,
20 CH₂CH₂OCH₂CH₂-C₂H₅, 2-(1-Methylpropoxy)ethyl, 2-(2-Methyl-
propoxy)ethyl, CH₂CH₂OC(CH₃)₃, CH₂CH₂O(CH₂)₃-C₂H₅,
CH₂CH₂O(CH₂)₄-C₂H₅, 2-(OCH₃)propyl, 2-(OC₂H₅)propyl,
2-(OCH₂-C₂H₅)propyl, 2-[OCH(CH₃)₂]propyl, 2-(OCH₂CH₂-C₂H₅)-
propyl, 2-(1-Methylpropoxy)propyl, 2-(2-Methylpropoxy)propyl,
25 2-[OC(CH₃)₃]propyl, 3-(OCH₃)propyl, 3-(OC₂H₅)propyl,
3-(OCH₂-C₂H₅)propyl, 3-[OCH(CH₃)₂]propyl, 3-(OCH₂CH₂-C₂H₅)-
propyl, 3-(1-Methylpropoxy)propyl, 3-(2-Methylpropoxy)-
propyl, 3-[OC(CH₃)₃]propyl, 3-[O(CH₂)₃-C₂H₅]propyl,
3-[O(CH₂)₄-C₂H₅]propyl, 2-(OCH₃)butyl, 2-(OC₂H₅)butyl,
30 2-(OCH₂-C₂H₅)butyl, 2-[OCH(CH₃)₂]butyl, 2-(OCH₂CH₂-C₂H₅)-
butyl, 2-(1-Methylpropoxy)butyl, 2-(2-Methylpropoxy)butyl,
2-[OC(CH₃)₃]butyl, 3-(OCH₃)butyl, 3-(OC₂H₅)butyl,
3-(OCH₂-C₂H₅)butyl, 3-[OCH(CH₃)₂]butyl, 3-(OCH₂CH₂-C₂H₅)-
butyl, 3-(1-Methylpropoxy)butyl, 3-(2-Methylpropoxy)butyl,
35 3-[OC(CH₃)₃]butyl, 4-(OCH₃)butyl, 4-(OC₂H₅)butyl,
4-(OCH₂-C₂H₅)butyl, 4-[OCH(CH₃)₂]butyl, 4-(OCH₂CH₂-C₂H₅)-
butyl, 4-(1-Methylpropoxy)butyl, 4-(2-Methylpropoxy)butyl,
4-[OC(CH₃)₃]butyl, 4-[O(CH₂)₃-C₂H₅]butyl, 4-[O(CH₂)₄-C₂H₅]-
butyl, 5-(OCH₃)pentyl, 5-(OC₂H₅)pentyl, 5-(OCH₂-C₂H₅)pentyl,
40 5-[OCH(CH₃)₂]pentyl, 5-(OCH₂CH₂-C₂H₅)pentyl, 5-(1-Methyl-
propoxy)pentyl, 5-(2-Methylpropoxy)pentyl, 5-[OC(CH₃)₃]pentyl,
5-[O(CH₂)₃-C₂H₅]pentyl, 5-[O(CH₂)₄-C₂H₅]pentyl, 6-(OCH₃)hexyl,
6-(OC₂H₅)hexyl, 6-(OCH₂-C₂H₅)hexyl, 6-[OCH(CH₃)₂]hexyl,
6-(OCH₂CH₂-C₂H₅)hexyl, 6-(1-Methylpropoxy)hexyl, 6-(2-Methyl-
45 propoxy)hexyl, 6-[OC(CH₃)₃]hexyl, 6-[O(CH₂)₃-C₂H₅]hexyl oder
6-[O(CH₂)₄-C₂H₅]hexyl, insbesondere für CH₂OCH₃, CH(CH₃)OCH₃,
CH₃CH₂OCH₃ oder CH(CH₃)CH₂OCH₃;

- Hydroxycarbonyl-C₁-C₆-alkyl für: z.B. CH₂COOH, CH(CH₃)COOH,
CH₂CH₂COOH, 1-(COOH)prop-1-yl, 2-(COOH)prop-1-yl,
3-(COOH)prop-1-yl, 1-(COOH)but-1-yl, 2-(COOH)but-1-yl,
3-(COOH)but-1-yl, 4-(COOH)but-1-yl, 1-(COOH)but-2-yl,
5 2-(COOH)but-2-yl, 3-(COOH)but-2-yl, 4-(COOH)but-2-yl,
1-(CH₂COOH)eth-1-yl, 1-(CH₂COOH)-1-(CH₃)-eth-1-yl,
1-(CH₂COOH)prop-1-yl, 5-(COOH)pent-1-yl oder
6-(COOH)hex-1-yl;
- 10 - (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl für: COOCH₃, COOC₂H₅, n-Propoxy-
carbonyl, OCH(CH₃)₂, n-Butoxycarbonyl, 1-Methylpropoxy-
carbonyl, 2-Methylpropoxycarbonyl, OC(CH₃)₃, n-Pentoxy-
carbonyl, 1-Methylbutoxycarbonyl, 2-Methylbutoxycarbonyl,
3-Methylbutoxycarbonyl, 2,2-Dimethylpropoxycarbonyl, 1-Ethyl-
15 propoxycarbonyl, n-Hexoxycarbonyl, 1,1-Dimethylpropoxy-
carbonyl, 1,2-Dimethylpropoxycarbonyl, 1-Methylpentoxy-
carbonyl, 2-Methylpentoxycarbonyl, 3-Methylpentoxycarbonyl,
4-Methylpentoxycarbonyl, 1,1-Dimethylbutoxycarbonyl, 1,2-Di-
methylbutoxycarbonyl, 1,3-Dimethylbutoxycarbonyl, 2,2-Di-
20 methylbutoxycarbonyl, 2,3-Dimethylbutoxycarbonyl, 3,3-Di-
methylbutoxycarbonyl, 1-Ethylbutoxycarbonyl, 2-Ethylbutoxy-
carbonyl, 1,1,2-Trimethylpropoxycarbonyl, 1,2,2-Trimethyl-
propoxycarbonyl, 1-C₂H₅-1-CH₃-propoxycarbonyl oder
1-C₂H₅-2-CH₃-propoxycarbonyl, insbesondere für COOCH₃,
25 COOC₂H₅ oder COOC(CH₃)₃;
- (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₆-alkyl für: durch (C₁-C₆-Alkoxy)-
carbonyl wie vorstehend genannt substituiertes C₁-C₆-Alkyl,
also z.B. für CH₂COOCH₃, CH₂COOC₂H₅, CH₂COOCH₂-C₂H₅,
30 CH₂COOCH(CH₃)₂, CH₂COOCH₂CH₂-C₂H₅, (1-Methylpropoxycarbonyl)-
methyl, (2-Methylpropoxycarbonyl)methyl, CH₂COOC(CH₃)₃,
CH₂COO(CH₂)₃-C₂H₅, CH₂COO(CH₂)₄-C₂H₅, CH(CH₃)COOCH₃,
CH(CH₃)COOC₂H₅, CH₂CH₂COOCH₃, CH₂CH₂COOC₂H₅, CH₂CH₂COOCH₂-C₂H₅,
35 CH₂CH₂COOCH(CH₃)₂, CH₂CH₂COOCH₂CH₂-C₂H₅, 2-(1-Methylpropoxy-
carbonyl)ethyl, 2-(2-Methylpropoxycarbonyl)ethyl,
CH₂CH₂COOC(CH₃)₃, CH₂CH₂COO(CH₂)₃-C₂H₅, CH₂CH₂COO(CH₂)₄-C₂H₅,
2-(COOCH₃)propyl, 2-(COOC₂H₅)propyl, 2-(COOCH₂-C₂H₅)propyl,
2-[COOCH(CH₃)₂]propyl, 2-(COOCH₂CH₂-C₂H₅)propyl, 2-(1-Methyl-
propoxycarbonyl)propyl, 2-(2-Methylpropoxycarbonyl)propyl,
40 2-[COOC(CH₃)₃]propyl, 3-(COOCH₃)propyl, 3-(COOC₂H₅)propyl,
3-(COOCH₂-C₂H₅)propyl, 3-[COOCH(CH₃)₂]propyl,
3-(COOCH₂CH₂-C₂H₅)propyl, 3-(1-Methylpropoxycarbonyl)propyl,
3-(2-Methylpropoxycarbonyl)propyl, 3-[COOC(CH₃)₃]propyl,
3-[COO(CH₂)₃-C₂H₅]propyl, 3-[COO(CH₂)₄-C₂H₅]propyl,
45 2-(COOCH₃)butyl, 2-(COOC₂H₅)butyl, 2-(COOCH₂-C₂H₅)butyl,
2-[COOCH(CH₃)₂]butyl, 2-(COOCH₂CH₂-C₂H₅)butyl, 2-(1-Methyl-
propoxycarbonyl)butyl, 2-(2-Methylpropoxycarbonyl)butyl.

2-[COOC(CH₃)₃]butyl, 3-(COOCH₃)butyl, 3-(COOC₂H₅)butyl,
 3-(COOCH₂-C₂H₅)butyl, 3-[COOCH(CH₃)₂]butyl,
 3-(COOCH₂CH₂-C₂H₅)butyl, 3-(1-Methylpropoxycarbonyl)butyl,
 3-(2-Methylpropoxycarbonyl)butyl, 3-[COOC(CH₃)₃]butyl,
 4-(COOCH₃)butyl, 4-(COOC₂H₅)butyl, 4-(COOCH₂-C₂H₅)butyl,
 4-[COOCH(CH₃)₂]butyl, 4-(COOCH₂CH₂-C₂H₅)butyl, 4-(1-Methyl-
 propoxycarbonyl)butyl, 4-(2-Methylpropoxycarbonyl)butyl,
 4-[COOC(CH₃)₃]butyl, 4-[COO(CH₂)₃-C₂H₅]butyl,
 4-[COO(CH₂)₄-C₂H₅]butyl, 5-(COOCH₃)pentyl, 5-(COOC₂H₅)pentyl,
 5-(COOCH₂-C₂H₅)pentyl, 5-[COOCH(CH₃)₂]pentyl,
 5-(COOCH₂CH₂-C₂H₅)pentyl, 5-(1-Methylpropoxycarbonyl)pentyl,
 5-(2-Methylpropoxycarbonyl)pentyl, 5-[COOC(CH₃)₃]pentyl,
 5-[COO(CH₂)₃-C₂H₅]pentyl, 5-[COO(CH₂)₄-C₂H₅]pentyl,
 6-(COOCH₃)hexyl, 6-(COOC₂H₅)hexyl, 6-(COOCH₂-C₂H₅)hexyl,
 6-[COOCH(CH₃)₂]hexyl, 6-(COOCH₂CH₂-C₂H₅)hexyl, 6-(1-Methyl-
 propoxycarbonyl)hexyl, 6-(2-Methylpropoxycarbonyl)hexyl,
 6-[COOC(CH₃)₃]hexyl, 6-[COO(CH₂)₃-C₂H₅]hexyl oder
 6-[COO(CH₂)₄-C₂H₅]hexyl, insbesondere für CH₂COOCH₃,
 CH₂COOCH(CH₃)₂ oder CH(CH₃)COOCH₃;
 20
 - (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₆-alkoxy für: durch (C₁-C₆-Alkoxy)-
 carbonyl wie vorstehend genannt substituiertes C₁-C₆-Alkoxy,
 also z.B. für OCH₂COOCH₃, OCH₂COOC₂H₅, OCH₂COOCH₂-C₂H₅,
 OCH₂COOCH(CH₃)₂, OCH₂COOCH₂CH₂-C₂H₅, (1-Methylpropoxycarbonyl)-
 25 methoxy, (2-Methylpropoxycarbonyl)methoxy, OCH₂COOC(CH₃)₃,
 OCH₂COO(CH₂)₃-C₂H₅, OCH₂COO(CH₂)₄-C₂H₅, OCH(CH₃)COOCH₃,
 OCH(CH₃)COOC₂H₅, OCH₂CH₂COOCH₃, OCH₂CH₂COOC₂H₅,
 OCH₂CH₂COOCH₂-C₂H₅, OCH₂CH₂COOCH(CH₃)₂, OCH₂CH₂COOCH₂CH₂-C₂H₅,
 2-(1-Methylpropoxycarbonyl)ethoxy, 2-(2-Methylpropoxy-
 30 carbonyl)ethoxy, OCH₂CH₂COOC(CH₃)₃, OCH₂CH₂COO(CH₂)₃-C₂H₅,
 OCH₂CH₂COO(CH₂)₄-C₂H₅, 2-(COOCH₃)propoxy, 2-(COOC₂H₅)propoxy,
 2-(COOCH₂-C₂H₅)propoxy, 2-[COOCH(CH₃)₂]propoxy,
 2-(COOCH₂CH₂-C₂H₅)propoxy, 2-(1-Methylpropoxycarbonyl)propoxy,
 2-(2-Methylpropoxycarbonyl)propoxy, 2-[COOC(CH₃)₃]propoxy,
 35 3-(COOCH₃)propoxy, 3-(COOC₂H₅)propoxy, 3-(COOCH₂-C₂H₅)propoxy,
 3-[COOCH(CH₃)₂]propoxy, 3-(COOCH₂CH₂-C₂H₅)propoxy,
 3-(1-Methylpropoxycarbonyl)propoxy, 3-[COOC(CH₃)₃]propoxy,
 3-[COO(CH₂)₃-C₂H₅]propoxy, 3-[COO(CH₂)₄-C₂H₅]propoxy,
 40 2-(COOCH₃)butoxy, 2-(COOC₂H₅)butoxy, 2-(COOCH₂-C₂H₅)butoxy,
 2-[COOCH(CH₃)₂]butoxy, 2-(COOCH₂CH₂-C₂H₅)butoxy, 2-(1-Methyl-
 propoxycarbonyl)butoxy, 2-(2-Methylpropoxycarbonyl)butoxy,
 2-[COOC(CH₃)₃]butoxy, 3-(COOCH₃)butoxy, 3-(COOC₂H₅)butoxy,
 3-(COOCH₂-C₂H₅)butoxy, 3-[COOCH(CH₃)₂]butoxy,
 45 3-(COOCH₂CH₂-C₂H₅)butoxy, 3-(1-Methylpropoxycarbonyl)butoxy,
 3-(2-Methylpropoxycarbonyl)butoxy, 3-[COOC(CH₃)₃]butoxy,
 4-(COOCH₃)butoxy, 4-(COOC₂H₅)butoxy, 4-(COOCH₂-C₂H₅)butoxy,

4-[COOCH(CH₃)₂]butoxy, 4-(COOCH₂CH₂-C₂H₅)butoxy, 4-(1-Methyl-
 propoxycarbonyl)butoxy, 4-(2-Methylpropoxycarbonyl)butoxy,
 4-[COOC(CH₃)₃]butoxy, 4-[COO(CH₂)₃-C₂H₅]butoxy,
 4-[COO(CH₂)₄-C₂H₅]butoxy, 5-(COOCH₃)pentoxy, 5-(COOC₂H₅)-
 5
 pentoxy, 5-(COOCH₂-C₂H₅)pentoxy, 5-[COOCH(CH₃)₂]pentoxy,
 5-(COOCH₂CH₂-C₂H₅)pentoxy, 5-(1-Methylpropoxycarbonyl)pentoxy,
 5-(2-Methylpropoxycarbonyl)pentoxy, 5-[COOC(CH₃)₃]pentoxy,
 5-[COO(CH₂)₃-C₂H₅]pentoxy, 5-[COO(CH₂)₄-C₂H₅]pentoxy,
 6-(COOCH₃)hexoxy, 6-(COOC₂H₅)hexoxy, 6-(COOCH₂-C₂H₅)hexoxy,
 10
 6-[COOCH(CH₃)₂]hexoxy, 6-(COOCH₂CH₂-C₂H₅)hexoxy, 6-(1-Methyl-
 propoxycarbonyl)hexoxy, 6-(2-Methylpropoxycarbonyl)hexoxy,
 6-[COOC(CH₃)₃]hexoxy, 6-[COO(CH₂)₃-C₂H₅]hexoxy oder
 6-[COO(CH₂)₄-C₂H₅]hexoxy, insbesondere für OCH₂COOCH₃,
 OCH₂COOCH(CH₃)₂, OCH(CH₃)COOCH₃ oder OCH₂CH₂COOCH₃;
 15

- C₁-C₆-Alkylthio für: z.B. SCH₃, SC₂H₅, n-Propylthio, SCH(CH₃)₂,
 n-Butylthio, 1-Methylpropylthio, 2-Methylpropylthio, SC(CH₃)₃,
 n-Pentylthio, 1-Methylbutylthio, 2-Methylbutylthio, 3-Methyl-
 butylthio, 2,2-Dimethylpropylthio, 1-Ethylpropylthio,
 20
 n-Hexylthio, 1,1-Dimethylpropylthio, 1,2-Dimethylpropylthio,
 1-Methylpentylthio, 2-Methylpentylthio, 3-Methylpentylthio,
 4-Methylpentylthio, 1,1-Dimethylbutylthio, 1,2-Dimethylbutyl-
 thio, 1,3-Dimethylbutylthio, 2,2-Dimethylbutylthio, 2,3-Di-
 methylbutylthio, 3,3-Dimethylbutylthio, 1-Ethylbutylthio,
 25
 2-Ethylbutylthio, 1,1,2-Trimethylpropylthio, 1,2,2-Trimethyl-
 propylthio, 1-Ethyl-1-methylpropylthio oder 1-Ethyl-2-methyl-
 propylthio, insbesondere für SCH₃ oder SC₂H₅;
 - C₁-C₆-Halogenalkylthio für: einen C₁-C₆-Alkylthiorest wie vor-
 30
 stehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor,
 Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. für
 SCH₂F, SCHF₂, SCF₃, SCH₂Cl, SCH(Cl)₂, SC(Cl)₃, SCHFCl,
 SCF(Cl)₂, SCF₂Cl, SCF₂Br, 2-Fluorethylthio, 2-Chlorethylthio,
 2-Bromethylthio, 2-Iodethylthio, 2,2-Difluorethylthio,
 35
 2,2,2-Trifluorethylthio, 2,2,2-Trichlorethylthio, 2-Chlor-2-
 fluorethylthio, 2-Chlor-2,2-difluorethylthio, 2,2-Dichlor-2-
 fluorethylthio, SC₂F₅, 2-Fluorpropylthio, 3-Fluorpropylthio,
 2-Chlorpropylthio, 3-Chlorpropylthio, 2-Brompropylthio,
 3-Brompropylthio, 2,2-Difluorpropylthio, 2,3-Difluorpropyl-
 thio, 2,3-Dichlorpropylthio, 3,3,3-Trifluorpropylthio,
 40
 3,3,3-Trichlorpropylthio, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropylthio,
 Heptafluorpropylthio, 1-(CH₂F)-2-fluorethylthio,
 1-(CH₂Cl)-2-chlorethylthio, 1-(CH₂Br)-2-bromethylthio,
 4-Fluorbutylthio, 4-Chlorbutylthio, 4-Brombutylthio, 5-Fluor-
 45
 pentylthio, 5-Chlorpentylthio, 5-Brompentoxy, 5-Iodpentoxy,
 Undecafluorpentoxy, 6-Fluorhexylthio oder 6-Chlorhexylthio,
 insbesondere für SCHF₂, SCF₃ oder SC(Cl)₃;

- C₁-C₆-Alkylsulfinyl für: z.B. SOCH₃, SOC₂H₅, n-Propylsulfinyl, SOCH(CH₃)₂, n-Butylsulfinyl, 1-Methylpropylsulfinyl, 2-Methylpropylsulfinyl, SOC(CH₃)₃, n-Pentylsulfinyl, 1-Methylbutylsulfinyl, 2-Methylbutylsulfinyl, 3-Methylbutylsulfinyl, 2,2-Dimethylpropylsulfinyl, 1-Ethylpropylsulfinyl, n-Hexylsulfinyl, 1,1-Dimethylpropylsulfinyl, 1,2-Dimethylpropylsulfinyl, 1-Methylpentylsulfinyl, 2-Methylpentylsulfinyl, 3-Methylpentylsulfinyl, 4-Methylpentylsulfinyl, 1,1-Dimethylbutylsulfinyl, 1,2-Dimethylbutylsulfinyl, 1,3-Dimethylbutylsulfinyl, 2,2-Dimethylbutylsulfinyl, 1-Ethylbutylsulfinyl, 2-Ethylbutylsulfinyl, 1,1,2-Trimethylpropylsulfinyl, 1,2,2-Trimethylpropylsulfinyl, 1-Ethyl-1-methylpropylsulfinyl oder 1-Ethyl-2-methylpropylsulfinyl, insbesondere für SOCH₃ oder SOC₂H₅;
- C₁-C₆-Alkylsulfonyl für: z.B. SO₂CH₃, SO₂C₂H₅, n-Propylsulfonyl, SO₂CH(CH₃)₂, n-Butylsulfonyl, 1-Methylpropylsulfonyl, 2-Methylpropylsulfonyl, SO₂C(CH₃)₃, n-Pentylsulfonyl, 1-Methylbutylsulfonyl, 2-Methylbutylsulfonyl, 3-Methylbutylsulfonyl, 2,2-Dimethylpropylsulfonyl, 1-Ethylpropylsulfonyl, n-Hexylsulfonyl, 1,1-Dimethylpropylsulfonyl, 1,2-Dimethylpropylsulfonyl, 1-Methylpentylsulfonyl, 2-Methylpentylsulfonyl, 3-Methylpentylsulfonyl, 4-Methylpentylsulfonyl, 1,1-Dimethylbutylsulfonyl, 1,2-Dimethylbutylsulfonyl, 1,3-Dimethylbutylsulfonyl, 2,2-Dimethylbutylsulfonyl, 3,3-Dimethylbutylsulfonyl, 1-Ethylbutylsulfonyl, 2-Ethylbutylsulfonyl, 1,1,2-Trimethylpropylsulfonyl, 1,2,2-Trimethylpropylsulfonyl, 1-Ethyl-1-methylpropylsulfonyl oder 1-Ethyl-2-methylpropylsulfonyl, insbesondere für SO₂CH₃ oder SO₂C₂H₅;
- C₁-C₆-Alkylaminosulfonyl für: z.B. H₃C-NHSO₂⁻, H₅C₂-NHSO₂⁻, n-Propyl-NHSO₂⁻, (CH₃)₂CH-NHSO₂⁻, n-Butyl-NHSO₂⁻, 1-Methylpropyl-NHSO₂⁻, 2-Methylpropyl-NHSO₂⁻, (CH₃)₃C-NHSO₂⁻, n-Pentyl-NHSO₂⁻, 1-Methylbutyl-NHSO₂⁻, 2-Methylbutyl-NHSO₂⁻, 3-Methylbutyl-NHSO₂⁻, 2,2-Dimethylpropyl-NHSO₂⁻, 1-Ethylpropyl-NHSO₂⁻, n-Hexyl-NHSO₂⁻, 1,1-Dimethylpropyl-NHSO₂⁻, 1,2-Dimethylpropyl-NHSO₂⁻, 1-Methylpentyl-NHSO₂⁻, 2-Methylpentyl-NHSO₂⁻, 3-Methylpentyl-NHSO₂⁻, 4-Methylpentyl-NHSO₂⁻, 1,1-Dimethylbutyl-NHSO₂⁻, 1,2-Dimethylbutyl-NHSO₂⁻, 1,3-Dimethylbutyl-NHSO₂⁻, 2,2-Dimethylbutyl-NHSO₂⁻, 2,3-Dimethylbutyl-NHSO₂⁻, 3,3-Dimethylbutyl-NHSO₂⁻, 1-Ethylbutyl-NHSO₂⁻, 2-Ethylbutyl-NHSO₂⁻, 1,1,2-Trimethylpropyl-NHSO₂⁻, 1,2,2-Trimethylpropyl-NHSO₂⁻, 1-Ethyl-1-methylpropyl-NHSO₂⁻ oder 1-Ethyl-2-methylpropyl-NHSO₂⁻, insbesondere für H₃C-NHSO₂⁻ oder H₅C₂-NHSO₂⁻;

- Di-(C₁-C₆-alkyl)aminosulfonyl für: z.B. (CH₃)₂N-SO₂⁻, (C₂H₅)₂N-SO₂⁻, N,N-Dipropylamino-SO₂⁻, N,N-Di(1-methyl-ethyl)amino-SO₂⁻, N,N-Dibutylamino-SO₂⁻, N,N-Di(1-methyl-propyl)amino-SO₂⁻, N,N-Di(2-methylpropyl)amino-SO₂⁻,
- 5 N,N-Di(1,1-dimethylethyl)amino-SO₂⁻, N-Ethyl-N-methyl-amino-SO₂⁻, N-Methyl-N-propylamino-SO₂⁻, N-Methyl-N-(1-methylethyl)amino-SO₂⁻, N-Butyl-N-methylamino-SO₂⁻, N-Methyl-N-(1-methylpropyl)amino-SO₂⁻, N-Methyl-N-(2-methyl-propyl)amino-SO₂⁻, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-methylamino-SO₂⁻,
- 10 N-Ethyl-N-propylamino-SO₂⁻, N-Ethyl-N-(1-methylethyl)amino-SO₂⁻, N-Butyl-N-ethylamino-SO₂⁻, N-Ethyl-N-(1-methylpropyl)-amino-SO₂⁻, N-Ethyl-N-(2-methylpropyl)amino-SO₂⁻, N-Ethyl-N-(1,1-dimethylethyl)amino-SO₂⁻, N-(1-Methylethyl)-N-propyl-amino-SO₂⁻, N-Butyl-N-propylamino-SO₂⁻, N-(1-Methylpropyl)-N-propylamino-SO₂⁻, N-(2-Methylpropyl)-N-propylamino-SO₂⁻,
- 15 N-(1,1-Dimethylethyl)-N-propylamino-SO₂⁻, N-Butyl-N-(1-methylethyl)amino-SO₂⁻, N-(1-Methylethyl)-N-(1-methyl-propyl)amino-SO₂⁻, N-(1-Methylethyl)-N-(2-methylpropyl)-amino-SO₂⁻, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylethyl)amino-SO₂⁻,
- 20 N-Butyl-N-(1-methylpropyl)amino-SO₂⁻, N-Butyl-N-(2-methyl-propyl)amino-SO₂⁻, N-Butyl-N-(1,1-dimethylethyl)amino-SO₂⁻, N-(1-Methylpropyl)-N-(2-methylpropyl)amino-SO₂⁻, N-(1,1-Di-methylethyl)-N-(2-methylpropyl)amino-SO₂⁻, insbesondere für
- 25 (CH₃)₂N-SO₂⁻, (C₂H₅)₂N-SO₂⁻ oder N-Ethyl-N-methylamino-SO₂⁻;

- C₃-C₆-Alkenyl für: z.B. Prop-1-en-1-yl, Allyl, 1-Methyl-ethenyl, n-Buten-1-yl, n-Buten-2-yl, n-Buten-3-yl, 1-Methyl-prop-1-en-1-yl, 2-Methylprop-1-en-1-yl, 1-Methylprop-2-en-1-yl, 2-Methylprop-2-en-1-yl, n-Penten-1-yl, n-Penten-2-yl, n-Penten-3-yl, n-Penten-4-yl, 1-Methylbut-1-en-1-yl, 2-Methylbut-1-en-1-yl, 3-Methylbut-1-en-1-yl, 1-Methyl-but-2-en-1-yl, 2-Methylbut-2-en-1-yl, 3-Methylbut-2-en-1-yl, 1-Methylbut-3-en-1-yl, 2-Methylbut-3-en-1-yl, 3-Methyl-but-3-en-1-yl, 1,1-Dimethyl-prop-2-en-1-yl, 1,2-Dimethyl-prop-1-en-1-yl, 1,2-Dimethyl-prop-2-en-1-yl, 1-Ethyl-prop-1-en-2-yl, 1-Ethylprop-2-en-1-yl, n-Hex-1-en-1-yl, n-Hex-2-en-1-yl, n-Hex-3-en-1-yl, n-Hex-4-en-1-yl, n-Hex-5-en-1-yl, 1-Methyl-pent-1-en-1-yl, 2-Methylpent-1-en-1-yl,
- 30 3-Methylpent-1-en-1-yl, 4-Methylpent-1-en-1-yl, 1-Methyl-pent-2-en-1-yl, 2-Methylpent-2-en-1-yl, 3-Methylpent-2-en-1-yl, 4-Methylpent-2-en-1-yl, 1-Methylpent-3-en-1-yl, 2-Methylpent-3-en-1-yl, 3-Methylpent-3-en-1-yl, 4-Methyl-pent-3-en-1-yl, 1-Methylpent-4-en-1-yl, 2-Methylpent-4-en-1-yl, 3-Methylpent-4-en-1-yl, 4-Methylpent-4-en-1-yl, 1,1-Di-methyl-but-2-en-1-yl, 1,1-Dimethyl-but-3-en-1-yl, 1,2-Di-methyl-but-1-en-1-yl, 1,2-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 1,2-Di-
- 35
- 40
- 45

5 methyl-but-3-en-1-yl, 1,3-Dimethyl-but-1-en-1-yl, 1,3-Di-
methy1-but-2-en-1-yl, 1,3-Dimethyl-but-3-en-1-yl, 2,2-Di-
methyl-but-3-en-1-yl, 2,3-Dimethyl-but-1-en-1-yl, 2,3-Di-
methyl-but-2-en-1-yl, 2,3-Dimethyl-but-3-en-1-yl, 3,3-Di-
methyl-but-1-en-1-yl, 3,3-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 1-Ethyl-
but-1-en-1-yl, 1-Ethylbut-2-en-1-yl, 1-Ethylbut-3-en-1-yl,
10 2-Ethylbut-1-en-1-yl, 2-Ethylbut-2-en-1-yl, 2-Ethylbut-3-
en-1-yl, 1,1,2-Trimethyl-prop-2-en-1-yl, 1-Ethyl-1-methyl-
prop-2-en-1-yl, 1-Ethyl-2-methyl-prop-1-en-1-yl oder
1-Ethyl-2-methyl-prop-2-en-1-yl, insbesondere für Allyl;

- C₃-C₆-Alkiny1 für: z.B. Prop-1-in-1-yl, Propargyl, n-But-1-
in-1-yl, n-But-1-in-3-yl, n-But-1-in-4-yl, n-But-2-in-1-yl,
n-Pent-1-in-1-yl, n-Pent-1-in-3-yl, n-Pent-1-in-4-yl, n-Pent-
15 1-in-5-yl, n-Pent-2-in-1-yl, n-Pent-2-in-4-yl, n-Pent-2-in-
5-yl, 3-Methyl-but-1-in-3-yl, 3-Methyl-but-1-in-4-yl, n-Hex-
1-in-1-yl, n-Hex-1-in-3-yl, n-Hex-1-in-4-yl, n-Hex-1-in-5-yl,
n-Hex-1-in-6-yl, n-Hex-2-in-1-yl, n-Hex-2-in-4-yl, n-Hex-2-
in-5-yl, n-Hex-2-in-6-yl, n-Hex-3-in-1-yl, n-Hex-3-in-2-yl,
20 3-Methyl-pent-1-in-1-yl, 3-Methyl-pent-1-in-3-yl, 3-Methyl-
pent-1-in-4-yl, 3-Methyl-pent-1-in-5-yl, 4-Methyl-pent-1-
in-1-yl, 4-Methyl-pent-2-in-4-yl oder 4-Methyl-pent-2-in-
5-yl, insbesondere für Propargyl;

25 - C₃-C₆-Alkenyloxy für: z.B. Prop-1-en-1-yloxy, Allyloxy,
1-Methylethenyloxy, n-Buten-1-yloxy, n-Buten-2-yloxy,
n-Buten-3-yloxy, 1-Methylprop-1-en-1-yloxy, 2-Methylprop-1-
en-1-yloxy, 1-Methylprop-2-en-1-yloxy, 2-Methylprop-2-en-
1-yloxy, n-Penten-1-yloxy, n-Penten-2-yloxy, n-Penten-3-ylo-
oxy, n-Penten-4-yloxy, 1-Methylbut-1-en-1-yloxy, 2-Methyl-
but-1-en-1-yloxy, 3-Methylbut-1-en-1-yloxy, 1-Methylbut-2-
en-1-yloxy, 2-Methylbut-2-en-1-yloxy, 3-Methylbut-2-en-1-yl-
oxy, 1-Methylbut-3-en-1-yloxy, 2-Methylbut-3-en-1-yloxy,
3-Methylbut-3-en-1-yloxy, 1,1-Dimethyl-prop-2-en-1-yloxy,
35 1,2-Dimethyl-prop-1-en-1-yloxy, 1,2-Dimethyl-prop-2-en-1-yl-
oxy, 1-Ethylprop-1-en-2-yloxy, 1-Ethylprop-2-en-1-yloxy,
n-Hex-1-en-1-yloxy, n-Hex-2-en-1-yloxy, n-Hex-3-en-1-yloxy,
n-Hex-4-en-1-yloxy, n-Hex-5-en-1-yloxy, 1-Methyl-pent-1-en-
1-yloxy, 2-Methylpent-1-en-1-yloxy, 3-Methylpent-1-en-1-yl-
oxy, 4-Methylpent-1-en-1-yloxy, 1-Methylpent-2-en-1-yloxy,
40 2-Methylpent-2-en-1-yloxy, 3-Methylpent-2-en-1-yloxy,
4-Methylpent-2-en-1-yloxy, 1-Methylpent-3-en-1-yloxy,
2-Methylpent-3-en-1-yloxy, 3-Methylpent-3-en-1-yloxy,
4-Methylpent-3-en-1-yloxy, 1-Methylpent-4-en-1-yloxy,
45 2-Methylpent-4-en-1-yloxy, 3-Methylpent-4-en-1-yloxy,
4-Methylpent-4-en-1-yloxy, 1,1-Dimethyl-but-2-en-1-yloxy,
1,1-Dimethyl-but-3-en-1-yloxy, 1,2-Dimethyl-but-1-en-1-yloxy,

1,2-Dimethyl-but-2-en-1-yloxy, 1,2-Dimethyl-but-3-en-1-yloxy,
1,3-Dimethyl-but-1-en-1-yloxy, 1,3-Dimethyl-but-2-en-1-yloxy,
1,3-Dimethyl-but-3-en-1-yloxy, 2,2-Dimethyl-but-3-en-1-yloxy,
2,3-Dimethyl-but-1-en-1-yloxy, 2,3-Dimethyl-but-2-en-1-yloxy,
5 2,3-Dimethyl-but-3-en-1-yloxy, 3,3-Dimethyl-but-1-en-1-yloxy,
3,3-Dimethyl-but-2-en-1-yloxy, 1-Ethylbut-1-en-1-yloxy,
1-Ethylbut-2-en-1-yloxy, 1-Ethylbut-3-en-1-yloxy, 2-Ethyl-
but-1-en-1-yloxy, 2-Ethylbut-2-en-1-yloxy, 2-Ethylbut-3-
en-1-yloxy, 1,1,2-Trimethyl-prop-2-en-1-yloxy, 1-Ethyl-1-
10 methyl-prop-2-en-1-yloxy, 1-Ethyl-2-methyl-prop-1-en-1-yloxy
oder 1-Ethyl-2-methyl-prop-2-en-1-yloxy, insbesondere für
Allyloxy;

- C₃-C₆-Alkinyloxy für: z.B. Prop-1-in-1-yloxy, Propargyloxy,
15 n-But-1-in-1-yloxy, n-But-1-in-3-yloxy, n-But-1-in-4-yloxy,
n-But-2-in-1-yloxy, n-Pent-1-in-1-yloxy, n-Pent-1-in-3-yloxy,
n-Pent-1-in-4-yloxy, n-Pent-1-in-5-yloxy, n-Pent-2-in-1-yl-
oxy, n-Pent-2-in-4-yloxy, n-Pent-2-in-5-yloxy, 3-Methyl-but-
1-in-3-yloxy, 3-Methyl-but-1-in-4-yloxy, n-Hex-1-in-1-yloxy,
20 n-Hex-1-in-3-yloxy, n-Hex-1-in-4-yloxy, n-Hex-1-in-5-yloxy,
n-Hex-1-in-6-yloxy, n-Hex-2-in-1-yloxy, n-Hex-2-in-4-yloxy,
n-Hex-2-in-5-yloxy, n-Hex-2-in-6-yloxy, n-Hex-3-in-1-yloxy,
n-Hex-3-in-2-yloxy, 3-Methyl-pent-1-in-1-yloxy, 3-Methyl-
pent-1-in-3-yloxy, 3-Methyl-pent-1-in-4-yloxy, 3-Methyl-
25 pent-1-in-5-yloxy, 4-Methyl-pent-1-in-1-yloxy, 4-Methyl-
pent-2-in-4-yloxy oder 4-Methyl-pent-2-in-5-yloxy, ins-
besondere für Propargyloxy.

Im Hinblick auf die Verwendung der substituierten 2-Phenyl-
30 pyridine I als Herbizide und/oder als desikkant/defoliant wirk-
same Verbindungen haben die Variablen vorzugsweise folgende Be-
deutungen, und zwar jeweils für sich allein oder in Kombination:

n Null;
35 R¹ C₁-C₆-Alkylsulfonyl, insbesondere SO₂CH₃;
R² Halogen, insbesondere Chlor;
40 R³ Wasserstoff, Fluor oder Chlor, besonders bevorzugt Fluor oder
Chlor, insbesondere Fluor;
R⁴ Cyano oder Halogen, besonders bevorzugt Cyano oder Chlor,
insbesondere Chlor;
45

R⁵ Wasserstoff, Nitro, Cyano, Hydroxylamino, C₁-C₆-Alkyl
(insbesondere CH₃), C₁-C₆-Halogenalkyl (insbesondere Halogen-
methyl), -COCl, -CO-OR⁶, -CO-O-(C₁-C₄-Alkylen)-CO-OR⁶,
-O-(C₁-C₄-Alkylen)-CO-OR⁶, -O-(C₁-C₄-Alkylen)-CO-O-(C₁-C₄-
Alkylen)-CO-OR⁶, -OR⁹, Formyl, -CH=N-OR¹⁵ oder -NH₂;

5 R⁶ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkinyl oder
C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl;

10 R⁹ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl oder C₃-C₆-Alkinyl;

R¹⁵ C₁-C₆-Alkyl.

15

20

25

30

35

40

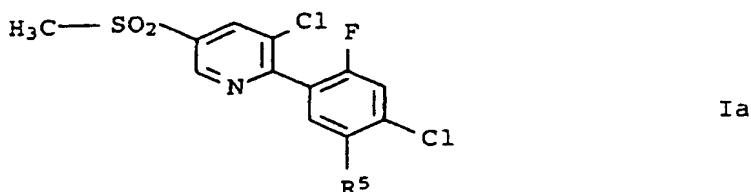
45

Ganz besonders bevorzugt sind die Verbindungen der Formel Ia (\approx I mit n = Null; R¹ = Methylsulfonyl; R² und R⁴ = Chlor; R³ = Fluor), insbesondere die Verbindungen der Tabelle 1:

5

Tabelle 1

10



15

20

25

30

35

40

45

Nr.	R ⁵
Ia.1	-H
Ia.2	-F
Ia.3	-Cl
Ia.4	-Br
Ia.5	-J
Ia.6	-CN
Ia.7	-CH ₃
Ia.8	-CH ₂ Cl
Ia.9	-CHCl ₂
Ia.10	-CCl ₃
Ia.11	-CH ₂ Br
Ia.12	-CHBr ₂
Ia.13	-COCl
Ia.14	-CO-OH
Ia.15	-CO-OCH ₃
Ia.16	-CO-OC ₂ H ₅
Ia.17	-CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.18	-CO-OCH(CH ₃) ₂
Ia.19	-CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.20	-CO-OCH ₂ -CH(CH ₃) ₂
Ia.21	-CO-OCH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.22	-CO-OCH ₂ -CCl ₃
Ia.23	-CO-OCH ₂ -CF ₃
Ia.24	-CO-OCH ₂ -CH=CH ₂
Ia.25	-CO-OCH ₂ -CH=CH-CH ₃
Ia.26	-CO-OCH ₂ -CH ₂ -CH=CH ₂
Ia.27	-CO-OCH(CH ₃) ₂ -CH=CH ₂
Ia.28	-CO-OCH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH=CH ₂

Nr.	R ⁵
Ia.29	-CO-OCH ₂ -CH=C(CH ₃) ₂
Ia.30	-CO-OCH ₂ -C(CH ₃)=CH-CH ₃
5 Ia.31	-CO-OCH ₂ -C≡CH
Ia.32	-CO-OCH(CH ₃)-C≡CH
Ia.33	-CO-OCH ₂ -C≡C-CH ₃
Ia.34	-CO-OCH ₂ -C≡C-C ₂ H ₅
10 Ia.35	-CO-O-cyclopropyl
Ia.36	-CO-O-cyclobutyl
Ia.37	-CO-O-cyclopentyl
Ia.38	-CO-O-cyclohexyl
15 Ia.39	-CO-OCH ₂ -CH ₂ -OCH ₃
Ia.40	-CO-OCH ₂ -CH ₂ -OC ₂ H ₅
Ia.41	-CO-OCH ₂ -CH ₂ -OCH ₂ -CH ₂ -CH ₃
Ia.42	-CO-OCH ₂ -CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂
Ia.43	-CO-O-(oxetan-3-yl)
20 Ia.44	-CO-NH ₂
Ia.45	-CO-NH-CH ₃
Ia.46	-CO-N(CH ₃) ₂
Ia.47	-CO-NH-CH ₂ -CO-OH
25 Ia.48	-CO-NH-CH ₂ -CO-OCH ₃
Ia.49	-CO-NH-CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅
Ia.50	-CO-NH-CH ₂ -CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.51	-CO-NH-CH ₂ -CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.52	-CO-NH-CH(CH ₃)-CO-OH
30 Ia.53	-CO-NH-CH(CH ₃)-CO-OCH ₃
Ia.54	-CO-NH-CH(CH ₃)-CO-OC ₂ H ₅
Ia.55	-CO-NH-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.56	-CO-NH-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
35 Ia.57	-CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OH
Ia.58	-CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OCH ₃
Ia.59	-CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅
Ia.60	-CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
40 Ia.61	-CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.62	-CO-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OH
Ia.63	-CO-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OCH ₃
Ia.64	-CO-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OC ₂ H ₅
45 Ia.65	-CO-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.66	-CO-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.67	-CO-pyrrolidin-1-yl

Nr.	R ⁵
Ia.68	-CO-piperidin-1-yl
Ia.69	-CO-[2-(COOCH ₃)-pyrrolidin-1-yl]
5 Ia.70	-CO-[2-(COOC ₂ H ₅)-pyrrolidin-1-yl]
Ia.71	-CO-OCH ₂ -CO-OH
Ia.72	-CO-OCH ₂ -CO-OCH ₃
Ia.73	-CO-OCH ₂ -CO-OC ₂ H ₅
10 Ia.74	-CO-OCH ₂ -CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.75	-CO-OCH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂
Ia.76	-CO-OCH ₂ -CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.77	-CO-OCH ₂ -CO-OCH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
Ia.78	-CO-OCH ₂ -CO-OCH(CH ₃)-C ₂ H ₅
15 Ia.79	-CO-OCH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃
Ia.80	-CO-OCH ₂ -CO-OCH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.81	-CO-OCH ₂ -CO-OCH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
Ia.82	-CO-OCH(CH ₃)-CO-OH
20 Ia.83	-CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₃
Ia.84	-CO-OCH(CH ₃)-CO-OC ₂ H ₅
Ia.85	-CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.86	-CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃) ₂
25 Ia.87	-CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.88	-CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH(CH ₃) ₂
Ia.89	-CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃)-C ₂ H ₅
Ia.90	-CO-OCH(CH ₃)-CO-OC(CH ₃) ₃
Ia.91	-CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
30 Ia.92	-CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
Ia.93	-CO-OCH ₂ -CO-NH ₂
Ia.94	-CO-OCH ₂ -CO-NH-CH ₃
Ia.95	-CO-OCH ₂ -CO-N(CH ₃) ₂
35 Ia.96	-CO-OCH ₂ -CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OH
Ia.97	-CO-OCH ₂ -CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OCH ₃
Ia.98	-CO-OCH ₂ -CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅
Ia.99	-CO-OCH ₂ -CO-pyrrolidin-1-yl
40 Ia.100	-CO-OCH ₂ -CO-piperidin-1-yl
Ia.101	-CO-OCH ₂ -CO-[2-(COOCH ₃)-pyrrolidin-1-yl]
Ia.102	-CO-OCH ₂ -CO-[2-(COOC ₂ H ₅)-pyrrolidin-1-yl]
Ia.103	-CO-OCH(CH ₃)-CO-NH ₂
Ia.104	-CO-OCH(CH ₃)-CO-NH-CH ₃
45 Ia.105	-CO-OCH(CH ₃)-CO-N(CH ₃) ₂
Ia.106	-CO-OCH(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OH

Nr.	R ⁵
Ia.107	-CO-OCH(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OCH ₃
Ia.108	-CO-OCH(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅
Ia.109	-CO-OCH(CH ₃)-CO-pyrrolidin-1-yl
Ia.110	-CO-OCH(CH ₃)-CO-piperidin-1-yl
Ia.111	-CO-OCH(CH ₃)-CO-[2-(COOCH ₃)-pyrrolidin-1-yl]
Ia.112	-CO-OCH(CH ₃)-CO-[2-(COOC ₂ H ₅)-pyrrolidin-1-yl]
Ia.113	-OCH ₂ -CHO
Ia.114	-OCH ₂ -CO-CH ₃
Ia.115	-OCH ₂ -CO-C ₂ H ₅
Ia.116	-OCH ₂ -CO-CH(CH ₃) ₂
Ia.117	-OCH ₂ -CO-CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.118	-OCH ₂ -CO-CH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.119	-OCH ₂ -CO-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
Ia.120	-OCH ₂ -CO-CH(CH ₃)-C ₂ H ₅
Ia.121	-OCH ₂ -CO-C(CH ₃) ₃
Ia.122	-OCH(CH ₃)-CO-CH ₃
Ia.123	-OCH(CH ₃)-CO-C ₂ H ₅
Ia.124	-OCH(CH ₃)-CO-CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.125	-OCH(CH ₃)-CO-CH(CH ₃) ₂
Ia.126	-OCH(CH ₃)-CO-CH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.127	-OCH(CH ₃)-CO-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
Ia.128	-OCH(CH ₃)-CO-CH(CH ₃)-C ₂ H ₅
Ia.129	-OCH(CH ₃)-CO-C(CH ₃) ₃
Ia.130	-OCH ₂ -CO-CH ₂ -Cl
Ia.131	-OCH(CH ₃)-CO-CH ₂ -CH=CH ₂
Ia.132	-OCH ₂ -CO-CH ₂ -CH=CH ₂
Ia.133	-OCH(CH ₃)-CO-CH ₂ -CH=CH ₂
Ia.134	-OCH ₂ -CO-CH ₂ -C≡CH
Ia.135	-OCH(CH ₃)-CO-CH ₂ -C≡CH
Ia.136	-OCH ₂ -CO-cyclopentyl
Ia.137	-OCH(CH ₃)-CO-cyclohexyl
Ia.138	-OCH ₂ -CO-CH ₂ -OCH ₃
Ia.139	-OCH(CH ₃)-CO-CH ₂ -OCH ₃
Ia.140	-OCH ₂ -CO-CH ₂ -OC ₂ H ₅
Ia.141	-OCH(CH ₃)-CO-CH ₂ -OC ₂ H ₅
Ia.142	-OCH ₂ -CO-CH ₂ -CH ₂ -OCH ₃
Ia.143	-OCH(CH ₃)-CO-CH ₂ -CH ₂ -OCH ₃
Ia.144	-OCH ₂ -CO-CH ₂ -CH ₂ -OC ₂ H ₅
Ia.145	-OCH(CH ₃)-CO-CH ₂ -CH ₂ -OC ₂ H ₅

Nr.	R ⁵
Ia.146	-SCH ₂ -CHO
Ia.147	-SCH ₂ -CO-CH ₃
5 Ia.148	-SCH ₂ -CO-C ₂ H ₅
Ia.149	-SCH ₂ -CO-CH(CH ₃) ₂
Ia.150	-SCH ₂ -CO-CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.151	-SCH(CH ₃)-CO-CH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
10 Ia.152	-SCH(CH ₃)-CO-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
Ia.153	-SCH(CH ₃)-CO-CH(CH ₃)-C ₂ H ₅
Ia.154	-SCH(CH ₃)-CO-C(CH ₃) ₃
Ia.155	-SCH ₂ -CO-CH ₂ -CH=CH ₂
Ia.156	-SCH(CH ₃)-CO-CH ₂ -CH=CH ₂
15 Ia.157	-SCH ₂ -CO-CH ₂ -CH≡CH
Ia.158	-SCH(CH ₃)-CO-CH ₂ -CH≡CH
Ia.159	-SCH ₂ -CO-cyclopentyl
Ia.160	-SCH(CH ₃)-CO-cyclopentyl
20 Ia.161	-SCH ₂ -CO-cyclohexyl
Ia.162	-SCH(CH ₃)-CO-cyclohexyl
Ia.163	-SCH ₂ -CO-CH ₂ -OCH ₃
Ia.164	-SCH(CH ₃)-CO-CH ₂ -OCH ₃
25 Ia.165	-SCH ₂ -CO-CH ₂ -OC ₂ H ₅
Ia.166	-SCH(CH ₃)-CO-CH ₂ -OC ₂ H ₅
Ia.167	-SCH ₂ -CO-CH ₂ -CH ₂ -OCH ₃
Ia.168	-SCH(CH ₃)-CO-CH ₂ -CH ₂ -OCH ₃
Ia.169	-SCH ₂ -CO-CH ₂ -CH ₂ -OC ₂ H ₅
30 Ia.170	-SCH(CH ₃)-CO-CH ₂ -CH ₂ -OC ₂ H ₅
Ia.171	-OCH ₂ -CO-OH
Ia.172	-OCH ₂ -CO-OCH ₃
Ia.173	-OCH ₂ -CO-OC ₂ H ₅
35 Ia.174	-OCH ₂ -CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.175	-OCH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂
Ia.176	-OCH ₂ -CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.177	-OCH ₂ -CO-OCH ₂ -CH(CH ₃) ₂
40 Ia.178	-OCH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃
Ia.179	-OCH ₂ -CO-OCH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.180	-OCH ₂ -CO-OCH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
Ia.181	-OCH(CH ₃)-CO-OH
Ia.182	-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₃
45 Ia.183	-OCH(CH ₃)-CO-OC ₂ H ₅
Ia.184	-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -OC ₂ H ₅

Nr.	R ⁵
Ia.185	-OCH(CH ₃) -CO -OCH(CH ₃) ₂
Ia.186	-OCH(CH ₃) -CO -OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
5 Ia.187	-OCH(CH ₃) -CO -OCH ₂ -CH(CH ₃) ₂
Ia.188	-OCH(CH ₃) -CO -OC(CH ₃) ₃
Ia.189	-OCH(CH ₃) -CO -OCH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.190	-OCH(CH ₃) -CO -OCH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
10 Ia.191	-SCH ₂ -CO -OH
Ia.192	-SCH ₂ -CO -OCH ₃
Ia.193	-SCH ₂ -CO -OC ₂ H ₅
Ia.194	-SCH ₂ -CO -OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.195	-SCH ₂ -CO -OCH(CH ₃) ₂
15 Ia.196	-SCH ₂ -CO -OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.197	-SCH ₂ -CO -OCH ₂ -CH(CH ₃) ₂
Ia.198	-SCH ₂ -CO -OC(CH ₃) ₃
Ia.199	-SCH ₂ -CO -OCH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
20 Ia.200	-SCH ₂ -CO -OCH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
Ia.201	-SCH(CH ₃) -CO -OH
Ia.202	-SCH(CH ₃) -CO -OCH ₃
Ia.203	-SCH(CH ₃) -CO -OC ₂ H ₅
25 Ia.204	-SCH(CH ₃) -CO -OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.205	-SCH(CH ₃) -CO -OCH(CH ₃) ₂
Ia.206	-SCH(CH ₃) -CO -OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.207	-SCH(CH ₃) -CO -OCH ₂ -CH(CH ₃) ₂
Ia.208	-SCH(CH ₃) -CO -OC(CH ₃) ₃
30 Ia.209	-SCH(CH ₃) -CO -OCH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.210	-SCH(CH ₃) -CO -OCH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
Ia.211	-OCH ₂ -CO -OCH ₂ -CO -OH
Ia.212	-OCH ₂ -CO -OCH ₂ -CO -OCH ₃
35 Ia.213	-OCH ₂ -CO -OCH ₂ -CO -OC ₂ H ₅
Ia.214	-OCH ₂ -CO -OCH ₂ -CO -OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.215	-OCH ₂ -CO -OCH ₂ -CO -OCH(CH ₃) ₂
Ia.216	-OCH ₂ -CO -OCH ₂ -CO -OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
40 Ia.217	-OCH ₂ -CO -OCH ₂ -CO -OCH ₂ -CH(CH ₃) ₂
Ia.218	-OCH ₂ -CO -OCH ₂ -CO -OCH(CH ₃) -C ₂ H ₅
Ia.219	-OCH ₂ -CO -OCH ₂ -CO -OC(CH ₃) ₃
Ia.220	-OCH ₂ -CO -OCH(CH ₃) -CO -OH
45 Ia.221	-OCH ₂ -CO ₂ -CH(CH ₃) -CO -OCH ₃
Ia.222	-OCH ₂ -CO -OCH(CH ₃) -CO -OC ₂ H ₅
Ia.223	-OCH ₂ -CO -OCH(CH ₃) -CO -OCH ₂ -C ₂ H ₅

Nr.	R ⁵
Ia.224	-OCH ₂ -CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃) ₂
Ia.225	-OCH ₂ -CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
5 Ia.226	-OCH ₂ -CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH(CH ₃) ₂
Ia.227	-OCH ₂ -CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃)-C ₂ H ₅
Ia.228	-OCH ₂ -CO-OCH(CH ₃)-CO-OC(CH ₃) ₃
Ia.229	-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CO-OH
10 Ia.230	-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CO-OCH ₃
Ia.231	-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CO-OC ₂ H ₅
Ia.232	-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.233	-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂
Ia.234	-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
15 Ia.235	-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CO-OCH ₂ -CH(CH ₃) ₂
Ia.236	-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CO-OCH(CH ₃)-C ₂ H ₅
Ia.237	-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃
Ia.238	-OCH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃)-CO-OH
20 Ia.239	-OCH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₃
Ia.240	-OCH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃)-CO-OC ₂ H ₅
Ia.241	-OCH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.242	-OCH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃) ₂
25 Ia.243	-OCH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.244	-OCH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH(CH ₃) ₂
Ia.245	-OCH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃)-C ₂ H ₅
Ia.246	-OCH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃)-CO-OC(CH ₃) ₃
Ia.247	-SCH ₂ -CO-OCH ₂ -CO-OH
30 Ia.248	-SCH ₂ -CO-OCH ₂ -CO-OCH ₃
Ia.249	-SCH ₂ -CO-OCH ₂ -CO-OC ₂ H ₅
Ia.250	-SCH ₂ -CO-OCH ₂ -CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.251	-SCH ₂ -CO-OCH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂
35 Ia.252	-SCH ₂ -CO-OCH ₂ -CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.253	-SCH ₂ -CO-OCH ₂ -CO-OCH ₂ -CH(CH ₃) ₂
Ia.254	-SCH ₂ -CO-OCH ₂ -CO-OCH(CH ₃)-C ₂ H ₅
Ia.255	-SCH ₂ -CO-OCH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃
40 Ia.256	-SCH ₂ -CO-OCH(CH ₃)-CO-OH
Ia.257	-SCH ₂ -CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₃
Ia.258	-SCH ₂ -CO-OCH(CH ₃)-CO-OC ₂ H ₅
Ia.259	-SCH ₂ -CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
45 Ia.260	-SCH ₂ -CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃) ₂
Ia.261	-SCH ₂ -CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.262	-SCH ₂ -CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH(CH ₃) ₂

Nr.	R ⁵
Ia.263	-SCH ₂ -CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃)-C ₂ H ₅
Ia.264	-SCH ₂ -CO-OCH(CH ₃)-CO-OC(CH ₃) ₃
Ia.265	-SCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CO-OH
Ia.266	-SCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CO-OCH ₃
Ia.267	-SCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CO-OC ₂ H ₅
Ia.268	-SCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.269	-SCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CO-OCH(CH ₃) ₂
Ia.270	-SCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.271	-SCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CO-OCH ₂ -CH(CH ₃) ₂
Ia.272	-SCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CO-OCH(CH ₃)-C ₂ H ₅
Ia.273	-SCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CO-OC(CH ₃) ₃
Ia.274	-SCH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃)-CO-OH
Ia.275	-SCH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₃
Ia.276	-SCH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃)-CO-OC ₂ H ₅
Ia.277	-SCH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.278	-SCH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃) ₂
Ia.279	-SCH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.280	-SCH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH(CH ₃) ₂
Ia.281	-SCH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃)-C ₂ H ₅
Ia.282	-SCH(CH ₃)-CO-OCH(CH ₃)-CO-OC(CH ₃) ₃
Ia.283	-OCH ₂ -CO-NH ₂
Ia.284	-OCH ₂ -CO-NH-CH ₃
Ia.285	-OCH ₂ -CO-N(CH ₃) ₂
Ia.286	-OCH ₂ -CO-NH-CH ₂ -CO-OH
Ia.287	-OCH ₂ -CO-NH-CH ₂ -CO-OCH ₃
Ia.288	-OCH ₂ -CO-NH-CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅
Ia.289	-OCH ₂ -CO-NH-CH ₂ -CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.290	-OCH ₂ -CO-NH-CH ₂ -CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.291	-OCH ₂ -CO-NH-CH(CH ₃)-CO-OH
Ia.292	-OCH ₂ -CO-NH-CH(CH ₃)-CO-OCH ₃
Ia.293	-OCH ₂ -CO-NH-CH(CH ₃)-CO-OC ₂ H ₅
Ia.294	-OCH ₂ -CO-NH-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.295	-OCH ₂ -CO-NH-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.296	-OCH ₂ -CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OH
Ia.297	-OCH ₂ -CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OCH ₃
Ia.298	-OCH ₂ -CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅
Ia.299	-OCH ₂ -CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.300	-OCH ₂ -CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.301	-OCH ₂ -CO-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OH

Nr.	R ⁵
Ia.302	-OCH ₂ -CO-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OCH ₃
Ia.303	-OCH ₂ -CO-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OC ₂ H ₅
5 Ia.304	-OCH ₂ -CO-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.305	-OCH ₂ -CO-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.306	-OCH(CH ₃)-CO-NH ₂
Ia.307	-OCH(CH ₃)-CO-NH-CH ₃
10 Ia.308	-OCH(CH ₃)-CO-N(CH ₃) ₂
Ia.309	-OCH(CH ₃)-CO-NH-CH ₂ -CO-OH
Ia.310	-OCH(CH ₃)-CO-NH-CH ₂ -CO-OCH ₃
Ia.311	-OCH(CH ₃)-CO-NH-CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅
Ia.312	-OCH(CH ₃)-CO-NH-CH ₂ -CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
15 Ia.313	-OCH(CH ₃)-CO-NH-CH ₂ -CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.314	-OCH(CH ₃)-CO-NH-CH(CH ₃)-CO-OH
Ia.315	-OCH(CH ₃)-CO-NH-CH(CH ₃)-CO-OCH ₃
Ia.316	-OCH(CH ₃)-CO-NH-CH(CH ₃)-CO-OC ₂ H ₅
20 Ia.317	-OCH(CH ₃)-CO-NH-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.318	-OCH(CH ₃)-CO-NH-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.319	-OCH(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OH
Ia.320	-OCH(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OCH ₃
25 Ia.321	-OCH(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅
Ia.322	-OCH(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.323	-OCH(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.324	-OCH(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OH
30 Ia.325	-OCH(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OCH ₃
Ia.326	-OCH(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OC ₂ H ₅
Ia.327	-OCH(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.328	-OCH(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.329	-SCH ₂ -CO-NH ₂
35 Ia.330	-SCH ₂ -CO-NH-CH ₃
Ia.331	-SCH ₂ -CO-N(CH ₃) ₂
Ia.332	-SCH ₂ -CO-NH-CH ₂ -CO-OH
Ia.333	-SCH ₂ -CO-NH-CH ₂ -CO-OCH ₃
40 Ia.334	-SCH ₂ -CO-NH-CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅
Ia.335	-SCH ₂ -CO-NH-CH ₂ -CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.336	-SCH ₂ -CO-NH-CH ₂ -CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.337	-SCH ₂ -CO-NH-CH(CH ₃)-CO-OH
45 Ia.338	-SCH ₂ -CO-NH-CH(CH ₃)-CO-OCH ₃
Ia.339	-SCH ₂ -CO-NH-CH(CH ₃)-CO-OC ₂ H ₅
Ia.340	-SCH ₂ -CO-NH-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅

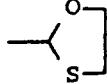
Nr.	R ⁵
Ia.341	-SCH ₂ -CO-NH-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.342	-SCH ₂ -CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OH
Ia.343	-SCH ₂ -CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OCH ₃
Ia.344	-SCH ₂ -CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅
Ia.345	-SCH ₂ -CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.346	-SCH ₂ -CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.347	-SCH ₂ -CO-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OH
Ia.348	-SCH ₂ -CO-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OCH ₃
Ia.349	-SCH ₂ -CO-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OC ₂ H ₅
Ia.350	-SCH ₂ -CO-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.351	-SCH ₂ -CO-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.352	-SCH(CH ₃)-CO-NH ₂
Ia.353	-SCH(CH ₃)-CO-NH-CH ₃
Ia.354	-SCH(CH ₃)-CO-N(CH ₃) ₂
Ia.355	-SCH(CH ₃)-CO-NH-CH ₂ -CO-OH
Ia.356	-SCH(CH ₃)-CO-NH-CH ₂ -CO-OCH ₃
Ia.357	-SCH(CH ₃)-CO-NH-CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅
Ia.358	-SCH(CH ₃)-CO-NH-CH ₂ -CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.359	-SCH(CH ₃)-CO-NH-CH ₂ -CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.360	-SCH(CH ₃)-CO-NH-CH(CH ₃)-CO-OH
Ia.361	-SCH(CH ₃)-CO-NH-CH(CH ₃)-CO-OCH ₃
Ia.362	-SCH(CH ₃)-CO-NH-CH(CH ₃)-CO-OC ₂ H ₅
Ia.363	-SCH(CH ₃)-CO-NH-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.364	-SCH(CH ₃)-CO-NH-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.365	-SCH(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OH
Ia.366	-SCH(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OCH ₃
Ia.367	-SCH(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅
Ia.368	-SCH(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.369	-SCH(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.370	-SCH(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OH
Ia.371	-SCH(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OCH ₃
Ia.372	-SCH(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OC ₂ H ₅
Ia.373	-SCH(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.374	-SCH(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.375	-OCH ₂ -CO-[2-(COOCH ₃)-pyrrolidin-1-y1]
Ia.376	-OCH ₂ -CO-[2-(COOC ₂ H ₅)-pyrrolidin-1-y1]
Ia.377	-OCH(CH ₃)-CO-[2-(COOCH ₃)-pyrrolidin-1-y1]
Ia.378	-OCH(CH ₃)-CO-[2-(COOC ₂ H ₅)-pyrrolidin-1-y1]
Ia.379	-SCH ₂ -CO-[2-(COOCH ₃)-pyrrolidin-1-y1]

Nr.	R ⁵
Ia.380	-SCH ₂ -CO-[2-(COOC ₂ H ₅)-pyrrolidin-1-yl]
Ia.381	-SCH(CH ₃)-CO-[2-(COOCH ₃)-pyrrolidin-1-yl]
5 Ia.382	-SCH(CH ₃)-CO-[2-(COOC ₂ H ₅)-pyrrolidin-1-yl]
Ia.383	-OH
Ia.384	-OCH ₃
Ia.385	-OC ₂ H ₅
10 Ia.386	-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.387	-OCH(CH ₃) ₂
Ia.388	-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.389	-OCH(CH ₃)-C ₂ H ₅
Ia.390	-OCH ₂ -CH(CH ₃) ₂
15 Ia.391	-OCH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.392	-OCH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₃
Ia.393	-OCH ₂ -CF ₃
Ia.394	-OCHF ₂
20 Ia.395	-OCH ₂ -CH=CH ₂
Ia.396	-OCH ₂ -CH=CH-CH ₃
Ia.397	-OCH ₂ -CH(CH ₃)=CH ₂
Ia.398	-OCH(CH ₃)-CH=CH ₂
25 Ia.399	-OCH ₂ -CH=CH-C ₂ H ₅
Ia.400	-OCH ₂ -CH ₂ -CH=CH-CH ₃
Ia.401	-OCH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH=CH ₂
Ia.402	-OCH ₂ -C≡CH
30 Ia.403	-OCH(CH ₃)-C≡CH
Ia.404	-OCH ₂ -C≡C-CH ₃
Ia.405	-OCH ₂ -C≡C-C ₂ H ₅
Ia.406	Cyclopropyloxy
Ia.407	Cyclobutyloxy
35 Ia.408	Cyclopentyloxy
Ia.409	Cyclohexyloxy
Ia.410	-OCH ₂ -CH ₂ -OCH ₃
Ia.411	-OCH ₂ -CH ₂ -OC ₂ H ₅
40 Ia.412	-OCH ₂ -CH ₂ -OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.413	-OCH ₂ -CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂
Ia.414	-SH
Ia.415	-SCH ₃
Ia.416	-SC ₂ H ₅
45 Ia.417	-SCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.418	-SCH(CH ₃) ₂

Nr.	R ⁵
Ia.419	-SCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.420	-SCH(CH ₃)-C ₂ H ₅
5 Ia.421	-SCH ₂ -CH(CH ₃) ₂
Ia.422	-SCH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.423	-SCH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₃
Ia.424	-SCH ₂ -CF ₃
10 Ia.425	-SCHF ₂
Ia.426	-SCH ₂ -CH=CH ₂
Ia.427	-SCH ₂ -CH=CH-CH ₃
Ia.428	-SCH ₂ -CH(CH ₃)=CH ₂
Ia.429	-SCH(CH ₃)-CH=CH ₂
15 Ia.430	-SCH ₂ -CH=CH-C ₂ H ₅
Ia.431	-SCH ₂ -CH ₂ -CH=CH-CH ₃
Ia.432	-SCH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH=CH ₂
Ia.433	-SCH ₂ -C≡CH
20 Ia.434	-SCH(CH ₃)-C≡CH
Ia.435	-SCH ₂ -C≡C-CH ₃
Ia.436	-SCH ₂ -C≡C-C ₂ H ₅
Ia.437	Cyclopropylthio
25 Ia.438	Cyclobutylthio
Ia.439	Cyclopentylthio
Ia.440	Cyclohexylthio
Ia.441	-SCH ₂ -CH ₂ -OCH ₃
Ia.442	-SCH ₂ -CH ₂ -OC ₂ H ₅
30 Ia.443	-SCH ₂ -CH ₂ -OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.444	-SCH ₂ -CH ₂ -OCH(CH ₃) ₂
Ia.445	-CH=CH ₂ -CO-OH
Ia.446	-CH=CH ₂ -CO-OCH ₃
35 Ia.447	-CH=CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅
Ia.448	-CH=CH ₂ -CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.449	-CH=CH ₂ -CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.450	-CH=CH(C ₁)-CO-OH
40 Ia.451	-CH=CH(C ₁)-CO-OCH ₃
Ia.452	-CH=CH(C ₁)-CO-OC ₂ H ₅
Ia.453	-CH=CH(C ₁)-CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.454	-CH=CH(C ₁)-CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
45 Ia.455	-CH=CH(CH ₃)-CO-OH
Ia.456	-CH=CH(CH ₃)-CO-OCH ₃
Ia.457	-CH=CH(CH ₃)-CO-OC ₂ H ₅

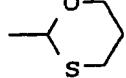
Nr.	R ⁵
Ia.458	-CH=CH(CH ₃) -CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.459	-CH=CH(CH ₃) -CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
5 Ia.460	-CH=CH-CO-NH ₂
Ia.461	-CH=CH-CO-NH-CH ₃
Ia.462	-CH=CH-CO-N(CH ₃) ₂
Ia.463	-CH=CH-CO-NH-CH ₂ -CO-OH
10 Ia.464	-CH=CH-CO-NH-CH ₂ -CO-OCH ₃
Ia.465	-CH=CH-CO-NH-CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅
Ia.466	-CH=CH-CO-NH-CH(CH ₃) -CO-OH
Ia.467	-CH=CH-CO-NH-CH(CH ₃) -CO-OCH ₃
Ia.468	-CH=CH-CO-NH-CH(CH ₃) -CO-OC ₂ H ₅
15 Ia.469	-CH=CH-CO-N(CH ₃) -CH ₂ -CO-OH
Ia.470	-CH=CH-CO-N(CH ₃) -CH ₂ -CO-OCH ₃
Ia.471	-CH=CH-CO-N(CH ₃) -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅
Ia.472	-CH=CH-CO-N(CH ₃) -CH(CH ₃) -CO-OH
20 Ia.473	-CH=CH-CO-N(CH ₃) -CH(CH ₃) -CO-OCH ₃
Ia.474	-CH=CH-CO-N(CH ₃) -CH(CH ₃) -CO-OC ₂ H ₅
Ia.475	-CH=C(C1)-CO-NH-CH(CH ₃) -CO-OH
Ia.476	-CH=C(C1)-CO-NH-CH(CH ₃) -CO-OCH ₃
25 Ia.477	-CH=C(C1)-CO-NH-CH(CH ₃) -CO-OC ₂ H ₅
Ia.478	-CH=C(C1)-CO-N(CH ₃) -CH ₂ -CO-OH
Ia.479	-CH=C(C1)-CO-N(CH ₃) -CH ₂ -CO-OCH ₃
Ia.480	-CH=C(C1)-CO-N(CH ₃) -CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅
Ia.481	-CH=C(C1)-CO-N(CH ₃) -CH(CH ₃) -CO-OH
30 Ia.482	-CH=C(C1)-CO-N(CH ₃) -CH(CH ₃) -CO-OCH ₃
Ia.483	-CH=C(C1)-CO-N(CH ₃) -CH(CH ₃) -CO-OC ₂ H ₅
Ia.484	-CH=C(C1)-CO-[2-(COOCH ₃)-pyrrolidin-1-y1]
Ia.485	-CH=C(C1)-CO-[2-(COOC ₂ H ₅)-pyrrolidin-1-y1]
35 Ia.486	-CHO
Ia.487	-CO-CH ₃
Ia.488	-CO-C ₂ H ₅
Ia.489	-CO-CH ₂ -C ₂ H ₅
40 Ia.490	-CO-CH(CH ₃) ₂
Ia.491	-CO-CH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.492	-CO-CH ₂ -CH(CH ₃) -CH ₃
Ia.493	-CO-CH(CH ₃) -C ₂ H ₅
Ia.494	-CO-CH ₂ -Cl
Ia.495	-CO-CH ₂ -Br
Ia.496	-CO-CHCl ₂

Nr.	R ⁵
Ia.497	-CO-CHBr ₂
Ia.498	-CO-CCl ₃
Ia.499	-CO-CF ₃
Ia.500	-CH=CH-CO-[2-(COOCH ₃)-pyrrolidin-1-yl]
Ia.501	-CH=CH-CO-[2-(COOC ₂ H ₅)-pyrrolidin-1-yl]
Ia.502	-CH=C(CH ₃)-CO-NH ₂
Ia.503	-CH=C(CH ₃)-CO-NH-CH ₃
Ia.504	-CH=C(CH ₃)-CO-N(CH ₃) ₂
Ia.505	-CH=C(CH ₃)-CO-NH-CH ₂ -CO-OH
Ia.506	-CH=C(CH ₃)-CO-NH-CH ₂ -CO-OCH ₃
Ia.507	-CH=C(CH ₃)-CO-NH-CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅
Ia.508	-CH=C(CH ₃)-CO-NH-CH(CH ₃)-CO-OH
Ia.509	-CH=C(CH ₃)-CO-NH-CH(CH ₃)-CO-OCH ₃
Ia.510	-CH=C(CH ₃)-CO-NH-CH(CH ₃)-CO-OC ₂ H ₅
Ia.511	-CH=C(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OH
Ia.512	-CH=C(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OCH ₃
Ia.513	-CH=C(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅
Ia.514	-CH=C(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OH
Ia.515	-CH=C(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OCH ₃
Ia.516	-CH=C(CH ₃)-CO-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OC ₂ H ₅
Ia.517	-CH=C(CH ₃)-CO-[2-(COOCH ₃)-pyrrolidin-1-yl]
Ia.518	-CH=C(CH ₃)-CO-[2-(COOC ₂ H ₅)-pyrrolidin-1-yl]
Ia.519	-CH=C(C1)-CO-NH ₂
Ia.520	-CH-C(C1)-CO-NH-CH ₃
Ia.521	-CH=C(C1)-CO-N(CH ₃) ₂
Ia.522	-CH=C(C1)-CO-NH-CH ₂ -CO-OH
Ia.523	-CH=C(C1)-CO-NH-CH ₂ -CO-OCH ₃
Ia.524	-CH=C(C1)-CO-NH-CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅
Ia.525	-CO-CH ₂ -CH=CH ₂
Ia.526	-CO-CH ₂ -CH=CH-CH ₃
Ia.527	-CO-CH ₂ -CH ₂ -CH=CH ₂
Ia.528	-CO-CH ₂ -C≡CH
Ia.529	-CO-CH(CH ₃)-C≡CH
Ia.530	-CO-CH ₂ -C≡C-CH ₃
Ia.531	Cyclopropylcarbonyl
Ia.532	Cyclobutylcarbonyl
Ia.533	Cyclopentylcarbonyl
Ia.534	Cyclohexylcarbonyl
Ia.535	-CO-CH ₂ -OCH ₃

Nr.	R ⁵
Ia.536	-CO-CH ₂ -OC ₂ H ₅
Ia.537	-CO-CH ₂ -CH ₂ -OCH ₃
5 Ia.538	-CO-CH ₂ -CH ₂ -OC ₂ H ₅
Ia.539	1,3-Dioxolan-2-yl
Ia.540	4-(CH ₃)-1,3-dioxolan-2-yl
Ia.541	4,5-(CH ₃) ₂ -1,3-dioxolan-2-yl
10 Ia.542	4,4-(CH ₃) ₂ -1,3-dioxolan-2-yl
Ia.543	4,4,5-(CH ₃) ₃ -1,3-dioxolan-2-yl
Ia.544	4,4,5,5-(CH ₃) ₄ -1,3-dioxolan-2-yl
Ia.545	4-(COOCH ₃)-1,3-dioxolan-2-yl
Ia.546	4-(COOC ₂ H ₅)-1,3-dioxolan-2-yl
15 Ia.547	4-(COOCH ₂ C ₂ H ₅)-1,3-dioxolan-2-yl
Ia.548	4-[COOCH(CH ₃) ₂]-1,3-dioxolan-2-yl
Ia.549	4-(COOCH ₂ CH ₂ -C ₂ H ₅)-1,3-dioxolan-2-yl
Ia.550	4-[COOCH ₂ CH(CH ₃) ₂]-1,3-dioxolan-2-yl
20 Ia.551	4-[COOCH(CH ₃)C ₂ H ₅]-1,3-dioxolan-2-yl
Ia.552	4-[COOC(CH ₃) ₃]-1,3-dioxolan-2-yl
Ia.553	4,5-(COOCH ₃) ₂ -1,3-dioxolan-2-yl
Ia.554	4,5-(COOC ₂ H ₅) ₂ -1,3-dioxolan-2-yl
25 Ia.555	
Ia.556	1,3-Dithiolan-2-yl
Ia.557	4-(CH ₃)-1,3-dithiolan-2-yl
30 Ia.558	4,5-(CH ₃) ₂ -1,3-dithiolan-2-yl
Ia.559	4,4-(CH ₃) ₂ -1,3-dithiolan-2-yl
Ia.560	4-(COOCH ₃)-1,3-dithiolan-2-yl
Ia.561	4-(COOC ₂ H ₅)-1,3-dithiolan-2-yl
35 Ia.562	4-(COOCH ₂ C ₂ H ₅)-1,3-dithiolan-2-yl
Ia.563	4-[COOCH(CH ₃) ₂]-1,3-dithiolan-2-yl
Ia.564	4-(COOCH ₂ CH ₂ C ₂ H ₅)-1,3-dithiolan-2-yl
Ia.565	4-[COOCH ₂ CH(CH ₃) ₂]-1,3-dithiolan-2-yl
40 Ia.566	4-[COOCH(CH ₃)C ₂ H ₅]-1,3-dithiolan-2-yl
Ia.567	4-[COOC(CH ₃) ₃]-1,3-dithiolan-2-yl
Ia.568	4,5-(COOCH ₃) ₂ -1,3-dithiolan-2-yl
Ia.569	4,5-(COOC ₂ H ₅) ₂ -1,3-dithiolan-2-yl
Ia.570	-CH=N-OH
45 Ia.571	-CH=N-OCH ₃
Ia.572	-CH=N-OC ₂ H ₅

Nr.	R ⁵
Ia.573	-CH=N-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.574	-CH=N-OCH(CH ₃) ₂
Ia.575	-CH=N-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.576	-CH=N-OCH ₂ -CH(CH ₃) ₂
Ia.577	-CH=N-OCH(CH ₃)-C ₂ H ₅
Ia.578	-CH=N-OC(CH ₃) ₃
Ia.579	-CH=N-OCH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.580	-CH=N-OCH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
Ia.581	-CH=N-OCH ₂ -CO-OCH ₃
Ia.582	-CH=N-OCH ₂ -CO-OC ₂ H ₅
Ia.583	-CH=N-OCH ₂ -CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.584	-CH=N-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₃
Ia.585	-CH=N-OCH(CH ₃)-CO-OC ₂ H ₅
Ia.586	-CH=N-OCH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.587	-CH(OCH ₃) ₂
Ia.588	-CH(OC ₂ H ₅) ₂
Ia.589	-CH(OCH ₂ -C ₂ H ₅) ₂
Ia.590	-CH(OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅) ₂
Ia.591	-NO ₂
Ia.592	-NH-OH
Ia.593	-NH ₂
Ia.594	-NH-CH ₃
Ia.595	-N(CH ₃) ₂
Ia.596	-NH-CH ₂ -CO-OCH ₃
Ia.597	-NH-CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅
Ia.598	-NH-CH ₂ -CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.599	-NH-CH ₂ -CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.600	-NH-CH(CH ₃)-CO-OCH ₃
Ia.601	-NH-CH(CH ₃)-CO-OC ₂ H ₅
Ia.602	-NH-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.603	-NH-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.604	-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OCH ₃
Ia.605	-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅
Ia.606	-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.607	-N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.608	-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OCH ₃
Ia.609	-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OC ₂ H ₅
Ia.610	-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.611	-N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OCH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅

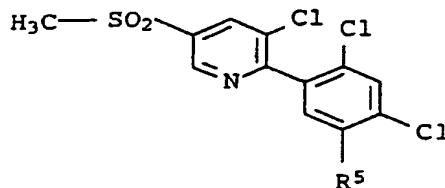
Nr.	R ⁵
Ia.612	-NH-SO ₂ -CH ₃
Ia.613	-NH-SO ₂ -C ₂ H ₅
5 Ia.614	-NH-SO ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.615	-NH-SO ₂ -CH(CH ₃) ₂
Ia.616	-NH-SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.617	-NH-SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
10 Ia.618	-NH-SO ₂ -CH(CH ₃)-C ₂ H ₅
Ia.619	-N(CH ₃)-SO ₂ -CH ₃
Ia.620	-N(CH ₃)-SO ₂ -C ₂ H ₅
Ia.621	-N(CH ₃)-SO ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.622	-N(CH ₃)-SO ₂ -CH(CH ₃) ₂
15 Ia.623	-N(CH ₃)-SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.624	-N(CH ₃)-SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
Ia.625	-NH-CO-CH ₃
Ia.626	-NH-CO-C ₂ H ₅
20 Ia.627	-NH-CO-CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.628	-NH-CO-CH(CH ₃) ₂
Ia.629	-NH-CO-CH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.630	-NH-CO-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
25 Ia.631	-NH-CO-CH(CH ₃)-C ₂ H ₅
Ia.632	-NH-CO-C(CH ₃) ₃
Ia.633	-N(CH ₃)-CO-CH ₃
Ia.634	-N(CH ₃)-CO-C ₂ H ₅
Ia.635	-N(CH ₃)-CO-CH ₂ -C ₂ H ₅
30 Ia.636	-N(CH ₃)-CO-CH(CH ₃) ₂
Ia.637	-N(CH ₃)-CO-CH ₂ -CH ₂ -C ₂ H ₅
Ia.638	-N(CH ₃)-CO-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
Ia.639	-N(CH ₃)-CO-CH(CH ₃)-C ₂ H ₅
35 Ia.640	-N(CH ₃)-CO-C(CH ₃) ₃
Ia.641	-SO ₂ -Cl
Ia.642	-SO ₂ -OH
Ia.643	-SO ₂ -NH ₂
40 Ia.644	-SO ₂ -NH-CH ₃
Ia.645	-SO ₂ -N(CH ₃) ₂
Ia.646	-SO ₂ -NH-CH ₂ -CO-OCH ₃
Ia.647	-SO ₂ -NH-CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅
45 Ia.648	-SO ₂ -NH-CH(CH ₃)-CO-OCH ₃
Ia.649	-SO ₂ -NH-CH(CH ₃)-CO-OC ₂ H ₅
Ia.650	-SO ₂ -N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OCH ₃

Nr.	R ⁵
Ia.651	-SO ₂ -N(CH ₃)-CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅
Ia.652	-SO ₂ -N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OCH ₃
5 Ia.653	-SO ₂ -N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CO-OC ₂ H ₅
Ia.654	1,3-Dioxan-2-yl
Ia.655	4-(CH ₃)-1,3-dioxan-2-yl
Ia.656	5-(CH ₃)-1,3-dioxan-2-yl
10 Ia.657	5,5-(CH ₃) ₂ -1,3-dioxan-2-yl
Ia.658	
Ia.659	1,3-Dithian-2-yl
15 Ia.660	4-(CH ₃)-dithian-2-yl
Ia.661	5-(CH ₃)-dithian-2-yl
Ia.662	5,5-(CH ₃) ₂ -dithian-2-yl

20 Des weiteren sind die substituierten 2-Phenylpyridine der Formeln Ib, Ic, Id, Ie und If ganz besonders bevorzugt, insbesondere

25 die Verbindungen Ib.1 bis Ib.662, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ia.1 bis Ia.662 lediglich dadurch unterscheiden, daß R³ für Chlor steht:

30

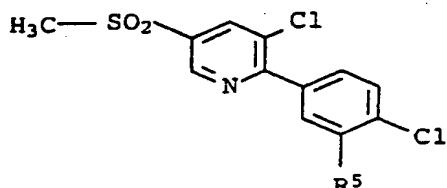


Ib

35

die Verbindungen Ic.1 bis Ic.662, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ia.1 bis Ia.662 lediglich dadurch unterscheiden, daß R³ für Wasserstoff steht:

40

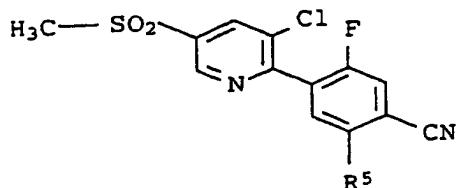


Ic

45

- die Verbindungen Id.1 bis Id.662, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ia.1 bis Ia.662 lediglich dadurch unterscheiden, daß R⁴ für Cyano steht:

5

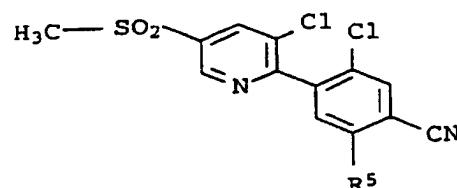


Id

10

- die Verbindungen Ie.1 bis Ie.662, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ia.1 bis Ia.662 lediglich dadurch unterscheiden, daß R³ für Chlor und R⁴ für Cyano stehen:

15

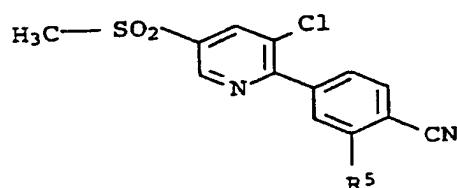


Ie

20

- die Verbindungen If.1 bis If.662, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ia.1 bis Ia.662 lediglich dadurch unterscheiden, daß R³ für Wasserstoff und R⁴ für Cyano stehen:

30



If

35

40

45

Die substituierten 2-Phenylpyridine der Formel I sind auf verschiedene Weise erhältlich, beispielsweise nach einem der folgenden Verfahren:

5

Verfahren A;

Oxidation von substituierten 2-Phenylpyridinen der Formel I, bei denen n Null bedeutet und R¹ und R⁵ keinen oxidierbaren Schwefel enthalten, auf an sich bekannte Weise {vgl. z.B. A. Albini & S. Pietra, Heterocyclic N-Oxides, CRC-Press Inc., Boca Raton, USA 1991; H.S. Mosher et al., Org. Synth. Coll. Vol. IV 1963, Seite 828; E.C. Taylor et al., Org. Synth. Coll. Vol. IV 1963, Seite 704; T.W. Bell et. al., Org. Synth. 52, Seite 226 (1990)}:

15



Unter den zur Oxidation des Pyridinrings üblichen Oxidationsmitteln sei beispielhaft auf Peressigsäure, Trifluorperessigsäure, Perbenzoësäure, m-Chlorperbenzoësäure, Monopermaleinsäure, Magnesiummonoperphthalat, Natriumperborat, Oxone® (enthält Peroxidisulfat), Perwolframsäure und Wasserstoffperoxid verwiesen.

25

Geeignete Lösungsmittel sind z.B. Wasser, Schwefelsäure, Carbonsäuren wie Essigsäure und Trifluoressigsäure sowie halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Dichlormethan und Chloroform.

30

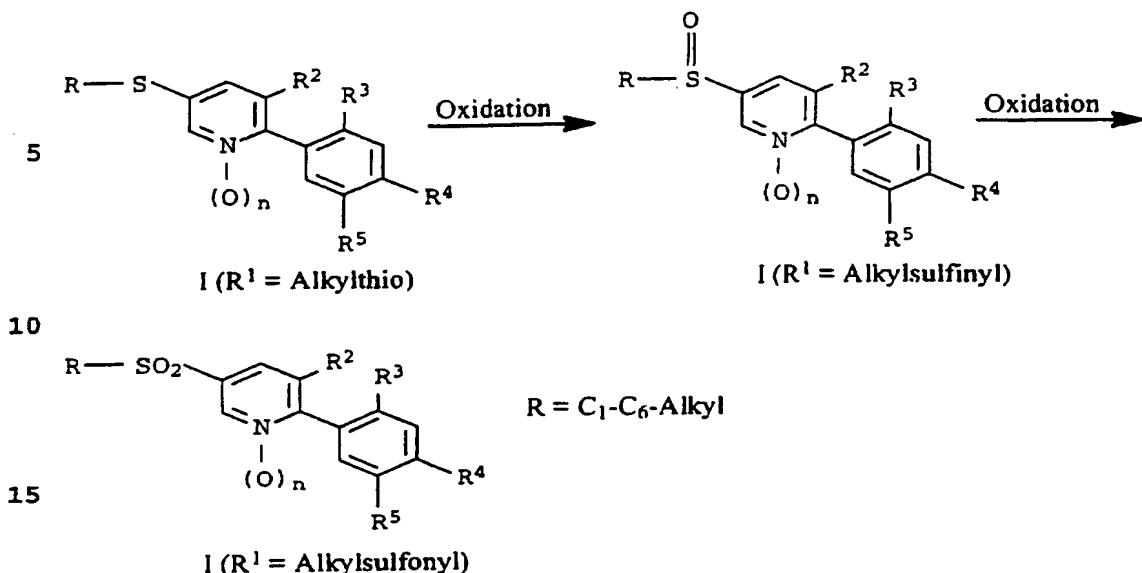
Normalerweise gelingt die Oxidation bei Temperaturen von 0°C bis Siedetemperatur des Reaktionsgemisches.

35

Das Oxidationsmittel wird normalerweise in mindestens äquimolaren Mengen, bezogen auf die Ausgangsverbindung, eingesetzt. Im allgemeinen hat sich ein Überschuß an Oxidationsmittel als besonders vorteilhaft erwiesen.

Verfahren B;

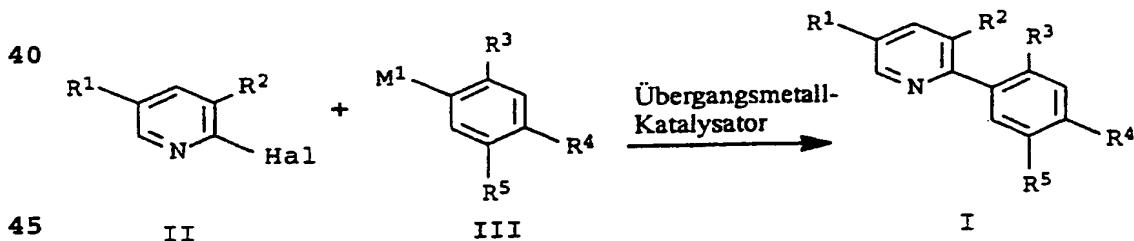
Oxidation von substituierten 2-Phenylpyridinen der Formel I, bei denen R¹ für C₁-C₆-Alkylthio oder C₁-C₆-Alkylsulfinyl steht und der Substituent R⁵ keinen oxidierbaren Schwefel enthält, auf an sich bekannte Weise {vgl. z.B. C.S. Giam et al., Org. Prep. Proced. Int. 13(2), S. 137 (1981); S.G. Woods et al., J. Heterocycl. Chem. 21, 97-101 (1984); S.G. Woods, U.S. 4,616,087; N. Finch et al., J. Med. Chem. 21(12), 1269-1274 (1978); H. Ban- Oganowska, Pd. J. Chem. 67(9), 1609-1613 (1993); A.D. Dunn & R. Norrie, J. Prakt. Chem./Chem.-Ztg. 335, 269-272 (1993)}:



Bezüglich geeigneter Lösungsmittel und Reaktionstemperaturen sei
 20 auf die Angaben bei Verfahren A, verwiesen. Neben den bei Ver-
 fahren A, genannten Oxidationsmitteln kommen hier auch Alkali-
 metallhypohalogenide wie Natrium- und Kaliumhypochlorid in
 Betracht.

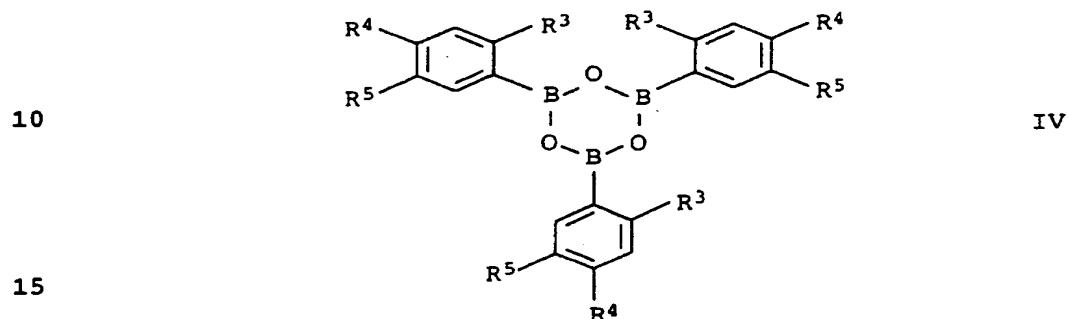
25 Zur Herstellung von Wertprodukten I mit $R^1 = \text{Alkylsulfinyl}$
 empfiehlt es sich, nicht mehr als ca. 1,1 Äquivalente des
 Oxidationsmittels einzusetzen. Zur Herstellung von I mit $R^1 =$
 Alkylsulfonyl ist es notwendig, mindestens ein Äquivalent oder
 mindestens zwei Äquivalente des Oxidationsmittels einzusetzen,
 30 je nachdem, ob man von den entsprechenden Verbindungen I mit
 $R^1 = \text{Alkylthio}$ oder mit $R^1 = \text{Alkylsulfinyl}$ ausgeht.

Verfahren C,
 Übergangsmetall-katalysierte Kreuzkupplungsreaktion von
 35 2-Halogenpyridinen II (Hal = Chlor oder Brom) mit metall-
 organischen Verbindungen der Formel III auf an sich bekannte
 Weise {vgl. z.B. WO 95/02580 und die dort auf den Seiten 21
 und 22 zitierte Literatur}:



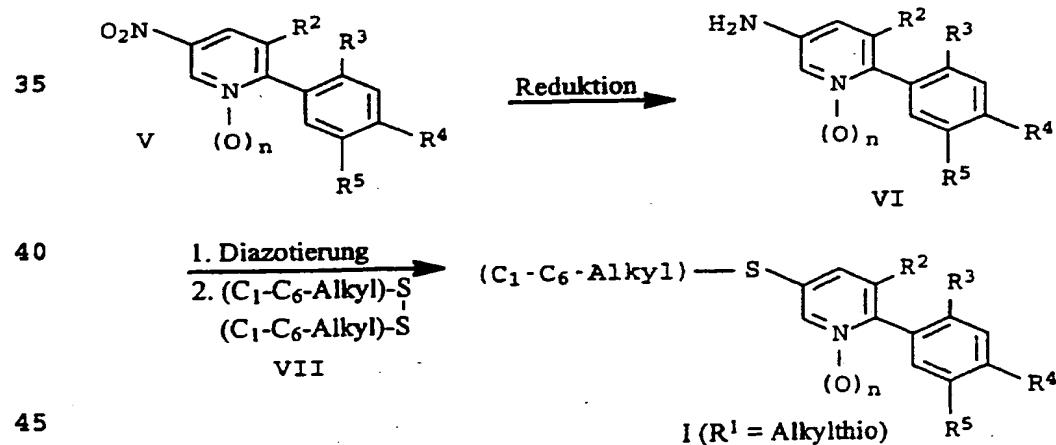
M¹ steht für B(OH)₂, Mg-Cl, Mg-Br, Mg-J, Zn-Cl, Zn-Br, Zn-J, Lithium, Kupfer oder Zinntri(C₁-C₄-alkyl), vorzugsweise für B(OH)₂, Mg-Cl, Mg-Br, Mg-J, Zn-Cl, Zn-Br oder Zn-J.

5 Alternativ können statt der Boronsäuren III {M¹ = B(OH)₂} auch die Boroxine IV eingesetzt werden.



Als Katalysatoren kommen insbesondere Palladiumkatalysatoren wie Tetrakis-(triphenylphosphin)-palladium(O), Bis-(triphenylphosphin)-palladium(II)-chlorid, 1,4-Bis-(diphenylphosphino)-butan-palladium(II)-chlorid, 1,2-Bis-(diphenylphosphino)-ethan-palladium(II)-chlorid, Palladium(II)-acetat + Triphenylphosphin, Palladium(II)-acetat + Tri-(o-tolyl)-phosphin oder Palladium auf Aktivkohle, und Nickelkatalysatoren wie Bis-(triphenylphosphin)-nickel(II)-chlorid, 1,3-Bis-(diphenylphosphino)-propan-nickel(II)-chlorid oder Nickel(II)-acetylacetone in Betracht.

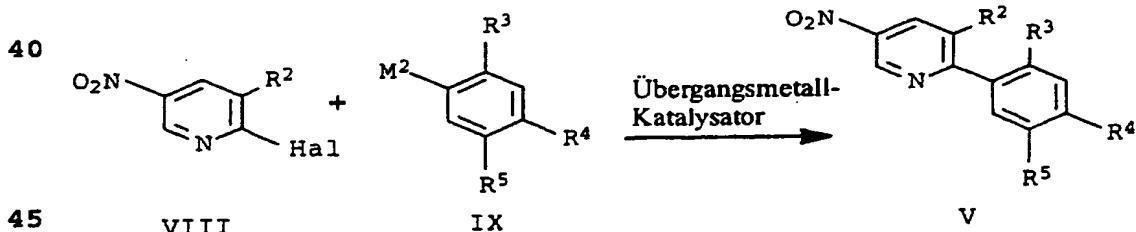
Verfahren D:
Reduktion von 5-Nitro-2-phenylpyridinen der Formel V zu
30 5-Amino-2-phenylpyridinen VI, Diazotierung der Aminogruppe und Umsetzung der Diazoniumsalze mit einem symmetrischen aliphatischen Disulfid der Formel VII auf an sich bekannte Weise:



Umsetzungen dieser Art sind allgemein bekannt, beispielsweise aus den folgenden Veröffentlichungen:

- Reduktion von Nitropyridinen mit Wasserstoff:
5 F. Janssens et al., J. Med. Chem. 28(12), S. 1943 (1985);
 - Reduktion von Nitropyridinen mit Eisen:
B.A. Fox et al., Org. Synth. 44, S. 34 (1964);
 - Reduktion von Nitropyridinen mit Zinn(II)chlorid:
L.A. Perez-Medina et al., J. Am. Chem. Soc. 69, S. 2574 (1947);
 - 10 - Reduktion von Nitropyridinen mit Hydrazin:
G. J. Clark et al., Aust. J. Chem. 34, S. 927 (1981);
 - Reduktion von Nitropyridinen mit Zinn:
K. Wojciechowski et al., Synthesis 8, 651-653 (1986);
 - Reduktion von Nitropyridinen mit niedervalenten Titanverbin-
15 dungen: M. Malinowski, B. Soc. Chim. Belg. 97(1), 51-53 (1988);
 - Reduktion von Nitropyridinen mit Bäckerhefe:
M. Takeshita et al., Heterocycles 31(12), 2201-2204 (1990);
 - Reduktion von Nitropyridinen mit Zink:
K. Goerlitzer et al., Arch. Pharm. 324(10), 785-796 (1991);
 - 20 - Reduktion von Nitropyridinen mit Natriumdithionit:
F.G. Fischer et al., Ann. Chem. 651, S. 49 (1962);
 - Diazotierung von Aminopyridinen mit Isoamylnitrit und Umsetzung
der Diazoniumsalze mit Dimethyldisulfid oder Diphenyldisulfid:
C.S. Giam et al., J. Chem. Soc., Chem. Commun. 16, S. 756
25 (1980);
T. Yasumitsu et al., J. Org. Chem. 46, 3564-3567 (1981).

2 - (4-Chlor-3-methoxyphenyl) - 5-nitropyridin, 2 - (4-Chlor-3-methoxyphenyl) - 3-chlor-5-nitropyridin, 5-Amino-2-(4-chlor-3-methoxyphenyl)-pyridin und 5-Amino-2-(4-chlor-3-methoxyphenyl)-3-chlor-pyridin sind bereits aus der WO 95/02580 bekannt. Von diesen Verbindungen abgesehen sind die 5-Nitro-2-phenylpyridine V und die 5-Amino-2-phenylpyridine VI neu. Die Herstellung von V erfolgt zweckmäßigerweise analog Verfahren C, durch Übergangsmetall-katalysierte Kreuzkupplungsreaktion von 2-Halogen-5-nitropyridinen der Formel VIII (Hal = Chlor oder Brom) mit metallorganischen Verbindungen der Formel IX {vgl. z.B. M.B. Mitchell et al., Tetrahedron Lett. 32, 2273-2276 (1991)}:

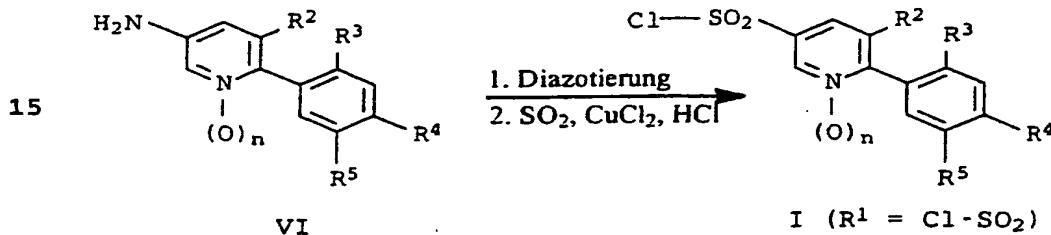


M² steht für B(OH)₂, Zn-Cl, Zn-Br, Zn-J, Kupfer oder Zinn-tri(C₁-C₄-alkyl).

Die unter Verfahren C, angegebenen Katalysatoren kommen auch hier in Betracht.

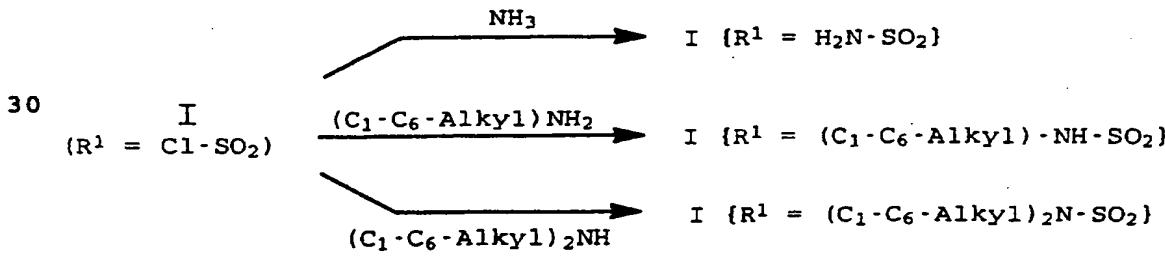
Verfahren E,

Diazotierung von 5-Amino-2-phenylpyridinen der Formel VI und Umsetzung der Diazoniumsalze mit SO₂ in Gegenwart von Kupfer(II)-chlorid {vgl. z.B. US 4,784,684 und Gilbert in Synthesis 1969, S. 6}:



20 Reaktion von I ($R^1 = SO_2Cl$) mit Ammoniak, primären oder sekundären Aminen führt zu den entsprechenden Verbindungen I mit $R^1 = H_2N-SO_2$, Alkyl-NH-SO₂ oder $(Alkyl)_2N-SO_2$ {vgl. z.B. C. Naegeli et al., Helv. Chim. Acta 25, 1485 (1942); M. Yasuhiro et al., J. Med. Chem. 23, 1376-1380 (1980);}

25 J.F. Liegeois et al., Helv. Chim. Acta 74, 8, 1764-1772 (1991) und P. De Tullio et al., Tetrahedron 51, 11, 3221-3234 (1995):



35 Die substituierten 2-Phenylpyridine I mit $R^1 = \text{Chlorsulfonyl}$
können außerdem auch zu den entsprechenden Verbindungen I mit
 $R^1 = \text{Hydroxysulfonyl}$ hydrolysiert werden.

40 Normalerweise sind die substituierten 2-Phenylpyridine I nach
einem der vorstehend genannten Syntheseverfahren herstellbar.
Aus wirtschaftlichen oder verfahrenstechnischen Gründen kann es
jedoch zweckmäßiger sein, einige Verbindungen I aus ähnlichen
45 2-Phenylpyridinen, die sich jedoch in der Bedeutung eines Restes
unterscheiden, herzustellen.

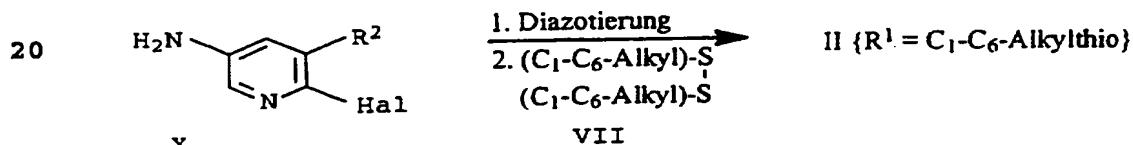
Die Verbindungen der Formel IIa



5 sind neu. 2-Chlor-5-methylthiopyridin ist z.B. aus J. Med. Chem. 16, 319-327 (1973) bekannt. Bezuglich 2-Chlor-5-methylsulfinyl- und 2-Chlor-5-methylsulfonylpyridin vgl. J. Med. Chem. 29, 427-433 (1986); bezüglich 2-Brom-5-tert.-butylthiopyridin sei auf Bull. Soc. Chim. Belg. 95, 1009-1020 (1986) verwiesen.

10

Allgemein kann die Herstellung der 2-Halogenpyridine II z.B. durch Diazotierung der entsprechenden 5-Aminopyridine X¹⁾ - vorzugsweise mit einem Salpetrigsäureester wie tert.-Butylnitrit und Isopentylnitrit - und anschließender Umsetzung des Diazoniumsalzes mit einem symmetrischen aliphatischen Disulfid VII erfolgen {vgl. z.B. J. Chem. Soc., Chem. Commun. 1980, S. 756/757}:



25 Die Diazotierung kann auch in Gegenwart des Disulfids VII stattfinden.

Vorzugsweise arbeitet man in einem wasserfreien System, beispielsweise in Eisessig, der Chlorwasserstoff enthält, in Dioxan, absolutem Ethanol, Tetrahydrofuran, Acetonitril

30 oder in Aceton.

Die Reaktionstemperatur liegt normalerweise bei (-30) bis 80°C.

Üblicherweise werden die Komponenten der Diazotierungsreaktion in etwa stöchiometrischem Verhältnis eingesetzt, jedoch kann auch ein Überschuß einer der Komponenten, z.B. im Hinblick auf eine möglichst vollständige Umsetzung der anderen Komponente, vorteilhaft sein. Bevorzugt verwendet man das Nitrit im Überschuß, bis etwa zur 2fachen molaren Menge, bezogen auf die

40 Menge an X.

Das Disulfid VII wird zweckmäßig in ca. äquimolaren Mengen oder im Überschuß, bezogen auf das Diazoniumsalz, eingesetzt. Im allgemeinen hat sich ein großer Überschuß an Disulfid VII (bis etwa zur 5fachen molaren Menge), bezogen auf die Menge an Diazoniumsalz, als besonders vorteilhaft erwiesen.

1) zu deren Herstellung siehe J. Med. Chem. 16, 319-327 (1973)

Die 2-Halogenpyridine II mit R¹ = C₁-C₆-Alkylthio können anschließend zu den entsprechenden Verbindungen mit R¹ = C₁-C₆-Alkyl-sulfinyl oder C₁-C₆-Alkylsulfonyl oxidiert werden, wie es unter Verfahren B, für die Verbindungen I mit R¹ = C₁-C₆-Alkylthio beschrieben wurde.

Sofern nicht anders angegeben werden alle vorstehend beschriebenen Verfahren zweckmäßigerweise bei Atmosphärendruck oder unter dem Eigendruck des jeweiligen Reaktionsgemisches vorgenommen.

10

Die Aufarbeitung der Reaktionsgemische erfolgt in der Regel nach an sich bekannten Methoden, beispielsweise durch Verdünnen der Reaktionslösung mit Wasser und anschließender Isolierung des Produktes mittels Filtration, Kristallisation oder 15 Lösungsmittelextraktion, oder durch Entfernen des Lösungsmittels, Verteilen des Rückstandes in einem Gemisch aus Wasser und einem geeigneten organischen Lösungsmittel und Aufarbeiten der organischen Phase auf das Produkt hin.

20

Die substituierten 2-Phenylpyridine I können bei der Herstellung als Isomerengemische anfallen, die jedoch gewünschtenfalls nach den hierfür üblichen Methoden wie Kristallisation oder Chromatographie, auch an einem optisch aktiven Adsorbat, in die weit- 25 gehend reinen Isomeren getrennt werden können. Reine optisch aktive Isomere lassen sich vorteilhaft aus entsprechenden optisch aktiven Ausgangsprodukten herstellen.

Landwirtschaftlich brauchbare Salze der Verbindungen I können 30 durch Reaktion mit einer Base des entsprechenden Kations, vorzugsweise einem Alkalimetallhydroxid oder -hydrid, gebildet werden.

Salze von I, deren Metallion kein Alkalimetallion ist, können 35 auch durch Umsalzen des entsprechenden Alkalimetallsalzes in üblicher Weise hergestellt werden, ebenso Ammonium-, Phosphonium-, Sulfonium- und Sulfoxoniumsalze mittels Ammoniak, Phosphonium-, Sulfonium- oder Sulfoxoniumhydroxiden.

40 Die Verbindungen I und deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze eignen sich - sowohl als Isomerengemische als auch in Form der reinen Isomeren - als Herbizide. Die I enthaltenden herbiziden Mittel bekämpfen Pflanzenwuchs auf Nichtkulturflächen sehr gut, besonders bei hohen Aufwandmengen. In Kulturen wie Weizen, Reis, 45 Mais, Soja und Baumwolle wirken sie gegen Unkräuter und Schad-

gräser; ohne die Kulturpflanzen nennenswert zu schädigen. Dieser Effekt tritt vor allem bei niedrigen Aufwandmengen auf.

In Abhängigkeit von der jeweiligen Applikationsmethode können 5 die Verbindungen I bzw. sie enthaltenden herbiziden Mittel noch in einer weiteren Zahl von Kulturpflanzen zur Beseitigung unerwünschter Pflanzen eingesetzt werden. In Betracht kommen beispielsweise folgende Kulturen:

Allium cepa, Ananas comosus, Arachis hypogaea, Asparagus officinalis, Beta vulgaris spec. altissima, Beta vulgaris spec. rapa, Brassica napus var. napus, Brassica napus var. napobrassica, Brassica rapa var. silvestris, Camellia sinensis, Carthamus tinctorius, Carya illinoiensis, Citrus limon, Citrus sinensis, Coffea arabica (Coffea canephora, Coffea liberica), 10 Cucumis sativus, Cynodon dactylon, Daucus carota, Elaeis guineensis, Fragaria vesca, Glycine max, Gossypium hirsutum, (Gossypium arboreum, Gossypium herbaceum, Gossypium vitifolium), Helianthus annuus, Hevea brasiliensis, Hordeum vulgare, Humulus lupulus, Ipomoea batatas, Juglans regia, Lens culinaris, Linum usitatissimum, Lycopersicon lycopersicum, Malus spec., Manihot esculenta, Medicago sativa, Musa spec., Nicotiana tabacum (N.rustica), Olea europaea, Oryza sativa, Phaseolus lunatus, 15 Phaseolus vulgaris, Picea abies, Pinus spec., Pisum sativum, Prunus avium, Prunus persica, Pyrus communis, Ribes sylvestre, Ricinus communis, Saccharum officinarum, Secale cereale, Solanum tuberosum, Sorghum bicolor (s. vulgare), Theobroma cacao, Trifolium pratense, Triticum aestivum, Triticum durum, Vicia faba, Vitis vinifera und Zea mays.

20 Darüber hinaus können die Verbindungen I auch in Kulturen, die durch Züchtung einschließlich gentechnischer Methoden gegen die Wirkung von Herbiziden tolerant sind, verwandt werden.

Des weiteren eignen sich die substituierten 2-Phenylpyridine I 25 auch zur Desikkation und/oder Defoliation von Pflanzen.

Als Desikkantien eignen sie sich insbesondere zur Austrocknung der oberirdischen Teile von Kulturpflanzen wie Kartoffel, Raps, Sonnenblume und Sojabohne. Damit wird ein vollständig mechanisches Beernten dieser wichtigen Kulturpflanzen ermöglicht.

Von wirtschaftlichem Interesse ist ferner die Ernteerleichterung, die durch das zeitlich konzentrierte Abfallen oder Vermindern der Haftfestigkeit am Baum bei Zitrusfrüchten, Oliven oder bei anderen Arten und Sorten von Kern-, Stein- und Schalenobst ermöglicht wird. Derselbe Mechanismus, das heißt die Förderung der Ausbildung von Trenngewebe zwischen Frucht- oder Blatt- und Sproßteil

der Pflanzen ist auch für ein gut kontrollierbares Entblättern von Nutzpflanzen, insbesondere Baumwolle, wesentlich.

Außerdem führt die Verkürzung des Zeitintervalls, in dem die 5 einzelnen Baumwollpflanzen reif werden, zu einer erhöhten Faserqualität nach der Ernte.

Die Verbindungen I bzw. die sie enthaltenden Mittel können beispielsweise in Form von direkt versprühbaren wässrigen Lösungen, Pulvern, Suspensionen, auch hochprozentigen wässrigen, öligen 10 oder sonstigen Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln oder Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich nach 15 den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

Als inerte Hilfsstoffe kommen im wesentlichen in Betracht: 20 Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt wie Kerosin und Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Paraffine, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline und deren Derivate, alkylierte Benzole und 25 deren Derivate, Alkohole wie Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol und Cyclohexanol, Ketone wie Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, z.B. Amine wie N-Methylpyrrolidon und Wasser.

Wässrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, 30 Suspensionen, Pasten, netzbaren Pulvern oder wasserdispergierbaren Granulaten durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substrate als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser 35 homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz, Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

40 Als oberflächenaktive Stoffe (Adjuvantien) kommen die Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von aromatischen Sulfonsäuren, z.B. Lignin-, Phenol-, Naphthalin- und Dibutynaphthalinsulfonsäure, sowie von Fettsäuren, Alkyl- und Alkylarylsulfonaten, Alkyl-, Laurylether- und Fettalkoholsulfaten, sowie Salze sulfatierter 45 Hexa-, Hepta- und Octadecanolen sowie von Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und seiner Derivate mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins

bzw. der Naphthalinsulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Poly-
oxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctyl-, Octyl- oder
Nonylphenol, Alkylphenyl-, Tributylphenylpolyglykolether, Alkyl-
arylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylen-
5 oxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylen- oder
Polyoxypropylenalkylether, Laurylalkoholpolyglykoletheracetat,
Sorbitester, Lignin-Sulfitablaugen oder Methylcellulose in
Betracht.

10 Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder
gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen
Trägerstoff hergestellt werden.

15 Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate
können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe her-
gestellt werden. Feste Trägerstoffe sind Mineralerden wie Kiesel-
säuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Kalkstein, Kalk,
Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und
Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Dünge-
20 mittel, wie Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat,
Harnstoffe und pflanzliche Produkte wie Getreidemehl, Baum-
rinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver oder andere
feste Trägerstoffe.

25 Die Konzentrationen der Wirkstoffe I in den anwendungsfertigen
Zubereitungen können in weiten Bereichen variiert werden. Im
allgemeinen enthalten die Formulierungen etwa von 0,001 bis
98 Gew.-%, vorzugsweise 0,01 bis 95 Gew.-%, mindestens eines
Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von
30 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) ein-
gesetzt.

Die folgenden Formulierungsbeispiele verdeutlichen die Her-
stellung solcher Zubereitungen:

35 I. 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. Ia.181 werden in einer
Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen alkyliertem
Benzol, 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 8
bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid.
40 5 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure
und 5 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol
Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusöl besteht. Durch Ausgießen und
feines Verteilen der Lösung in 100000 Gewichtsteilen Wasser
erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des
45 Wirkstoffs enthält.

- II. 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. Ia.384 werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 30 Gewichtsteilen Isobutanol, 20 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wässrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- III. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. Ia.402 werden in einer Mischung gelöst, die aus 25 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 65 Gewichtsteilen einer Mineralölfaktion vom Siedepunkt 210 bis 280°C und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wässrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- IV. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 2 werden mit 3 Gewichtsteilen des Natriumsalzes der Diisobutyl-naphthalin-a-sulfonsäure, 17 Gewichtsteilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gewichtsteilen pulverförmigem Kieselsäuregelpulpa vermisch und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- V. 3 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 3 werden mit 97 Gewichtsteilen feinteiligem Kaolin vermisch. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 3 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- VI. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 7 werden mit 2 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure, 8 Gewichtsteilen Fettalkohol-polyglykolether, 2 Gewichtsteilen Natriumsalz eines Phenol-Harnstoff-Formaldehydkondensates und 68 Gewichtsteilen eines paraffinischen Mineralöls innig vermisch. Man erhält eine stabile ölige Dispersion.
- VII. 1 Gewichtsteil des Wirkstoffs Nr. 10 wird in einer Mischung gelöst, die aus 70 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 20 Gewichtsteilen ethoxyliertem Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen ethoxyliertem Rizinusöl besteht. Man erhält ein stabiles Emulsionskonzentrat.

VIII. 1 Gewichtsteil des Wirkstoffs Nr. 13 wird in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen Cyclohexanon und 20 Gewichtsteilen Wettol® EM 31 (= nichtionischer Emulgator auf der Basis von ethoxyliertem Rizinusöl; BASF AG) besteht. Man erhält ein stabiles Emulsionskonzentrat.

Die Applikation der Wirkstoffe I bzw. der herbiziden Mittel kann im Vorauflauf- oder im Nachauflaufverfahren erfolgen. Sind die Wirkstoffe für gewisse Kulturpflanzen weniger verträglich, so können Ausbringungstechniken angewandt werden, bei welchen die herbiziden Mittel mit Hilfe der Spritzgeräte so gespritzt werden, daß die Blätter der empfindlichen Kulturpflanzen nach Möglichkeit nicht getroffen werden, während die Wirkstoffe auf die Blätter darunter wachsender unerwünschter Pflanzen oder die unbedeckte Bodenfläche gelangen (post-directed, lay-by).

Die Aufwandmengen an Wirkstoff I betragen je nach Bekämpfungsziel, Jahreszeit, Zielpflanzen und Wachstumsstadium 0,001 bis 3,0, vorzugsweise 0,01 bis 1,0 kg/ha aktive Substanz (a.S.).

Zur Verbreiterung des Wirkungsspektrums und zur Erzielung synergistischer Effekte können die substituierten 2-Phenylpyridine I mit zahlreichen Vertretern anderer herbizider oder wachstumsregulierender Wirkstoffgruppen gemischt und gemeinsam ausgebracht werden. Beispielsweise kommen als Mischungspartner 1,2,4-Thiadiazole, 1,3,4-Thiadiazole, Amide, Aminophosphorsäure und deren Derivate, Aminotriazole, Anilide, Aryloxy-/Heteroaryloxyalkansäuren und deren Derivate, Benzoësäure und deren Derivate, Benzo-thiadiazinone, 2-(Hetaryl/Aroyl)-1,3-cyclohexandione, Heteroaryl-Aryl-Ketone, Benzylisoxazolidinone, meta-CF₃-PhenylDerivate, Carbamate, Chinolin carbonsäure und deren Derivate, Chloracetanilide, Cyclohexan-1,3-dionederivate, Diazine, Dichlorpropionsäure und deren Derivate, Dihydrobenzofurane, Dihydrofuran-3-one, Dinitroaniline, Dinitrophenole, Diphenylether, Dipyridyle, Halogencarbonsäuren und deren Derivate, Harnstoffe, 3-Phenyluracile, Imidazole, Imidazolinone, N-Phenyl-3,4,5,6-tetrahydrophthalimide, Oxadiazole, Oxirane, Phenole, Aryloxy- und Heteroaryloxyphenoxypropionsäureester, Phenylessigsäure und deren Derivate, 2-Phenylpropionsäure und deren Derivate, Pyrazole, Phenylpyrazole, Pyridazine, Pyridincarbonsäure und deren Derivate, Pyrimidylether, Sulfonamide, Sulfonylharnstoffe, Triazine, Triazinone, Triazolinone, Triazolcarboxamide und Uracile in Betracht.

Außerdem kann es von Nutzen sein, die Verbindungen I allein oder in Kombination mit anderen Herbiziden auch noch mit weiteren Pflanzenschutzmitteln gemischt, gemeinsam auszubringen, bei-

spielsweise mit Mitteln zur Bekämpfung von Schädlingen oder phytopathogenen Pilzen bzw. Bakterien. Von Interesse ist ferner die Mischbarkeit mit Mineralsalzlösungen, welche zur Behebung von Ernährungs- und Spurenelementmängeln eingesetzt werden. Es können 5 auch nichtphytotoxische Öle und Ölkonzentrate zugesetzt werden.

Herstellungsbeispiele

Beispiel 1 (Verbindung Ia.384 in Tabelle 1):

10

12,1 g (2,3-Dichlor-5-methylsulfonylpyridin, 11,05 g 4-Chlor-2-fluor-5-methoxybenzolboronsäure, 13,6 g Natriumhydrogencarbonat und 2,0 g Tetrakis(triphenylphosphin)-palladium(0) wurden in 360 ml einer Tetrahydrofuran/Wasser-Mischung (1:1) 120 Stunden 15 auf Rückflußtemperatur erhitzt. Nach Abkühlen auf Raumtemperatur extrahierte man dreimal mit je 200 ml Methyl-tert.-butylether (MTB). Die vereinigten organischen Phasen wurden mit 100 ml Wasser gewaschen, dann über Natriumsulfat getrocknet und schließlich eingeengt. Die Reinigung des Rohproduktes erfolgte mittels 20 Säulenchromatographie an Kieselgel (Laufmittel: Cyclohexan/MTB = 10:1 → 7:3 → 1:1). Die erhaltenen weißen Kristalle (5,8 g) wurden durch Ausröhren mit MTB/Petrolether (1:1) weiter gereinigt. Ausbeute: 5,2 g (27 %); Smp.: 184-185°C.

25 Vorstufe α: 2,3-Dichlor-5-methylthio-pyridin

Zu einer Lösung von 56,6 g (0,6 mol) Dimethyldisulfid und 46,7 g (0,45 mol) tert.-Butylnitrit in 320 ml trockenem Methylenchlorid tropfte man langsam bei 40°C eine Lösung von 50,6 g (0,3 mol) 30 3-Amino-5,6-dichlorpyridin in 700 ml Methylenchlorid. Dann wurde die Mischung 1 Std. bei 40°C und anschließend noch etwa 15 Std. bei ca. 20°C gerührt, wonach man 500 ml Eiswasser zum Reaktionsgemisch gab. Die abgetrennte organische Phase wurde einmal mit 1 N Salzsäure und einmal mit Wasser gewaschen, über Natriumsulfat 35 getrocknet und schließlich eingeengt. Nach Verrühren des Rohprodukts mit n-Hexan erhielt man 21 g eines dunklen Feststoffs (94 % Reinheit nach GC). Nach Einengen der Hexanlösung verblieben noch 21,3 g Wertprodukt mit einer Reinheit von 77 % (nach GC). Gesamtausbeute: 62 %; Fp.: 66-67°C; ¹H-NMR (in d⁶-Dimethyl-40 sulfoxid): δ [ppm] = 2,6 (s, CH₃); 8,1 und 8,3 (2xd, Pyr-H).

Vorstufe β: 2,3-Dichlor-5-methylsulfinyl-pyridin

Zu einer Suspension von 10 g (0,052 mol) 2,3-Dichlor-5-methyl-45 thio-pyridin in 60 ml Methylenchlorid wurden portionsweise 8,9 g (0,052 mol) m-Chlorperbenzoësäure gegeben. Nach 2 Std. Rühren bei ca. 20°C versetzte man die Mischung mit weiteren 0,9 g (5 mmol)

m-Chlorperbenzoësäure. Anschließend wurde noch 2 Std. auf Rückflußtemperatur erhitzt. Nach dem Abkühlen trennte man den Feststoffanteil ab, wonach die organische Phase einmal mit Natriumhydrogensulfit, einmal mit Natriumhydrogencarbonat und einmal mit Wasser gewaschen wurde. Nach Trocknen über Natriumsulfat engte man ein. Das als rotes Öl erhaltene Rohprodukt wurde mittels "Flashchromatographie" an Kieselgel (Laufmittel: Cyclohexan/Essigester = 1:1) gereinigt. Ausbeute: 6,3 g (58 %) als braunes Öl; $^1\text{H-NMR}$ (in d^6 -Dimethylsulfoxid): δ [ppm] = 2,9 (s, CH_3); 8,4 und 10 8,7 (2xd, Pyr-H).

Vorstufe γ: 2,3-Dichlor-5-methylsulfonyl-pyridin

Zu einer Lösung von 73,7 g (0,38 mol) 2,3-Dichlor-5-methylthiopyridin in 380 ml Eisessig wurden 6,2 g (0,02 mol) $\text{Na}_2\text{WO}_4 \cdot 2\text{H}_2\text{O}$ gegeben. Nach Erhitzen auf 40-50°C versetzte man die Mischung vorsichtig mit 95 g Wasserstoffperoxid (30%ig). Anschließend wurde noch 1 Std. bei ca. 20°C nachgerührt. Dann gab man das Gemisch in 300 ml Wasser. Von der erhaltenen Suspension wurde das Produkt abgetrennt, mit Wasser und n-Pentan gewaschen und bei reduziertem Druck getrocknet. Ausbeute: 60 g (70 %) als braunes Pulver; Fp.: 129-130°C; $^1\text{H-NMR}$ (in d^6 -Dimethylsulfoxid): δ [ppm] = 3,4 (s, CH_3); 8,7 und 8,9 (2xd, Pyr-H).

25 Beispiel 2 (Verbindung Ia.383 in Tabelle 1):

4,15 g der nach Beispiel 1 gewonnenen Verbindung Ia.384 und 10,2 g Pyridinhydrochlorid wurden vier Stunden unter Stickstoff-Atmosphäre auf 200°C erhitzt. Nach dem Abkühlen nahm man die Reaktionsmischung in 100 ml 10%iger Salzsäure auf. Dann extrahierte man das Produkt fünfmal mit je 90 ml Dichlormethan. Die vereinigten organischen Phasen wurden mit 100 ml Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und schließlich eingeengt. Die Reinigung der erhaltenen Kristalle erfolgte durch Verrühren mit MTB/Petrolether (1:1). Nach Abtrennen und Trocknen erhielt man 3,6 g (90 %) weißer Kristalle; Smp.: 176-178°C.

Beispiel 3 (Verbindung Ia.402 in Tabelle 1):

40 Zu 1,2 g der nach Beispiel 2 hergestellten Verbindung Ia.383 und 0,99 g Kaliumcarbonat in 80 ml wasserfreiem Dimethylformamid wurden tropfenweise 0,52 g Propargylbromid gegeben. Nach zwölfständigem Rühren bei 23°C verdünnte man mit 200 ml Wasser. Dann extrahierte man das Produkt viermal mit je 100 ml MTB. Die ver-einigten organischen Phasen wurden mit 100 ml Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und schließlich eingeengt. Die Reinigung des Rohproduktes erfolgte durch Verrühren mit n-Hexan/

Diethylether (10:1). Nach Abtrennen und Trocknen erhielt man 0,9 g (67 %) weißer Kristalle; Smp.: 182-183°C.

Beispiel 4 (Verbindung Ia.182 in Tabelle 1; (R)-Enantiomer):

5

Zu 2,4 g der nach Beispiel 2 hergestellten Verbindung Ia.383 und 1,97 g Kaliumcarbonat in 100 ml wasserfreiem Dimethylformamid wurden tropfenweise 1,05 g (S)-2-Chlorpropionsäuremethylester gegeben. Nach sechzigstündigem Rühren bei 23°C verdünnte man mit 10 300 ml Wasser. Dann extrahierte man das Produkt viermal mit je 80 ml MTB. Die vereinigten organischen Phasen wurden mit 100 ml Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und schließlich eingeeengt. Die Reinigung des Rohproduktes erfolgte mittels Chromatographie an Kieselgel (Laufmittel: Cyclohexan/MTB = 15 5:1 → 7:1). Ausbeute: 2,6 g (86 %) eines farblosen Öls.
¹H-NMR (200 MHz; in CDCl₃): δ [ppm] = 1,70 (d, 3H), 3,20 (s, 3H), 3,77 (s, 3H), 4,78 (q, 1H), 7,00 (d, 1H), 7,28 (d, 1H), 8,33 (s, 1H), 9,07 (s, 1H).

20 Beispiel 5 (Verbindung Ia.181 in Tabelle 1; (R)-Enantiomer):

1,2 g der nach Beispiel 4 hergestellten Verbindung Ia.182 wurden in einer Mischung aus 25 ml Eisessig und 10 ml 2m-Salzsäure 4 Stunden bei 70 bis 80 °C und anschließend 16 Stunden bei 23°C 25 gerührt. Nach Verdünnen mit 100 ml Wasser extrahiert man fünfmal mit je 60 ml MTB. Die vereinigten organischen Phasen wurden zweimal mit je 60 ml gesättigter wäßriger Natriumchlorid-Lösung gewaschen, dann über Natriumsulfat getrocknet und schließlich eingeeengt. Die Reinigung des Rohproduktes erfolgte durch Ver- 30 rühren mit n-Hexan/Diethylether (2:1). Ausbeute: 0,75 g (65 %) weißer Kristalle; Smp.: 161-164°C.

Beispiel 6: 3-Chlor-2-(4-chlor-2-fluor-5-methoxyphenyl)-5-methyl-
sulfinylpyridin

35

4,6 g 2,3-Dichlor-5-methylsulfinylpyridin, 4,5 g 4-Chlor-2-fluor-5-methoxybenzolboronsäure, 5,5 g Natriumhydrogencarbonat und 1,0 g Tetrakis-(triphenylphosphin)-palladium(0) wurden in einer Mischung aus 100 ml Wasser und 100 ml Tetrahydrofuran 180 Stunden 40 auf Rückflußtemperatur erhitzt. Nach Abdampfen des Tetrahydrofurans extrahierte man viermal mit je 70 ml MTB. Dann wurden die vereinigten organischen Phasen über Natriumsulfat getrocknet und schließlich eingeeengt. Die Reinigung des erhaltenen Öls erfolgte mittels Chromatographie an Kieselgel (Laufmittel: Cyclohexan/MTB = 45 7:3 → 1:1 und Cyclohexan/Essigester = 2:1). Durch verrühren des so gereinigten Öls mit Diethylether erhielt man 2,2 g (30 %) weißer Kristalle; Smp.: 117-118°C.

Beispiel 7**Herstellung des Vorproduktes 2,3-Dichlor-5-ethylsulfonyl-pyridin:**

Analog Beispiel 1, Vorstufe γ wurden 5 g (0,024 mol) 2,3-Dichlor-
5-ethylthio-pyridin mit 0,4 g (1,2 mmol) $\text{Na}_2\text{WO}_4 \cdot 2\text{H}_2\text{O}$ und 6 g
Wasserstoffperoxid (30%ig) in 25 ml Eisessig umgesetzt. Nach der
Aufarbeitung erhielt man 5,1 g Wertprodukt als weißen Feststoff.
Ausbeute: 88,5 %; Fp.: 141-142°C; $^1\text{H-NMR}$ (in d^6 -Dimethylsulfoxid):
 δ [ppm] = 1,2 (t, CH_3); 3,5 (q, CH_2); 8,6 und 8,8 (2xd, Pyr-H).

10

Vorstufe α : 2,3-Dichlor-5-ethylthio-pyridin

Analog Beispiel 1, Vorstufe α wurden 24,45 g (0,15 mol) 3-Amino-
5,6-dichlorpyridin in 280 ml Methylenchlorid mit 36,6 g (0,3 mol)
15 Diethyldisulfid und 23,2 g (0,225 mol) tert.-Butylnitrit in 130 ml
Methylenchlorid umgesetzt. Nach Aufarbeitung und anschließendem
Auswaschen des Rohprodukts mit Ethanol erhielt man 13,3 g Wert-
produkt. Ausbeute: 42 %; $^1\text{H-NMR}$ (in d^6 -Dimethylsulfoxid): δ [ppm]
= 1,25 (t, CH_3); 3,10 (d, CH_2); 8,15 und 8,3 (2xd, Pyr-H).

20

Vorstufe β : 2,3-Dichlor-5-ethylsulfinyl-pyridin

Analog Beispiel 1, Vorstufe β wurden 4 g (0,02 mol) 2,3-Dichlor-
5-ethylthio-pyridin mit 3,47 g (0,02 mol) m-Chlorperbenzoësäure in
25 30 ml Methylenchlorid umgesetzt. Nach Reinigung des Rohproduktes
mittels Flashchromatographie an Kieselgel (Laufmittel: Cyclo-
hexan/Essigester = 2:1) erhielt man 1,9 g Wertprodukt in Form
von weißen Kristallen. Ausbeute: 42 %. Fp.: 78-79°C;
 $^1\text{H-NMR}$ (d^6 -Dimethylsulfoxid): δ [ppm] = 1,1 (t, CH_3); 3,0 und 3,2
30 (2xm, CH_2); 8,35 und 8,6 (2xs, Pyr-H).

Beispiel 8**Herstellung des Vorproduktes 2,3-Dichlor-5-isopropylsulfonyl-
pyridin:**

35

Analog zu Beispiel 1, Vorstufe γ wurden 15 g (0,068 mol)
2,3-Dichlor-5-isopropylthio-pyridin (Rohprodukt) mit 1,11 g
(3,6 mmol) $\text{Na}_2\text{WO}_4 \cdot 2\text{H}_2\text{O}$ und 17 g Wasserstoffperoxid (30%ig) in 80 ml
Essigsäure umgesetzt. Nach Aufarbeitung und zusätzlichem Aus-
40 rühren des Rohprodukts mit Ethanol erhielt man 3,5 g Wertprodukt
als helles Pulver. Ausbeute: 20%; Fp.: 146°C; $^1\text{H-NMR}$ (in d^6 -Di-
methylsulfoxid): δ [ppm] = 1,2 (d, 2x CH_3); 3,65 (m, CH); 8,6 und
8,8 (2xd, Pyr-H).

45

Vorstufe α : 2,3-Dichlor-5-isopropylthio-pyridin

Analog zu Beispiel 1, Vorstufe α wurden 13,1 g (0,08 mol) 3-Amino-5,6-dichlorpyridin in 120 ml Methylenchlorid mit 25 g (0,16 mol) 5 Diisopropylsulfid und 12,4 g (0,12 mol) tert.-Butylnitrit in 70 ml Methylenchlorid umgesetzt. Man erhielt 30 g eines dunklen Öls (ca. 40 % Wertprodukt), das ohne weitere Reinigung weiter umgesetzt wurde. $^1\text{H-NMR}$ (in d^6 -Dimethylsulfoxid): δ [ppm] = 1,25 (d, $2\times\text{CH}_3$); 3,7 (m, CH); 8,2 und 8,3 ($2\times\text{d}, \text{Pyr-H}$).

10

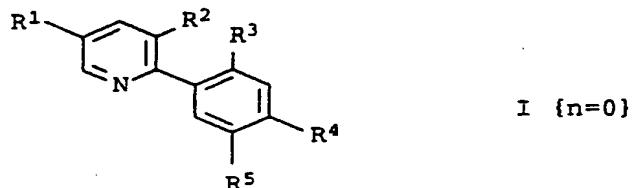
Vorstufe β : 2,3-Dichlor-5-isopropylsulfinyl-pyridin

Analog zu Beispiel 1, Vorstufe β wurden 10 g (0,045 mol) 2,3-Dichlor-5-isopropylthio-pyridin (als Rohprodukt) mit 7,8 g (0,045 mol) m-Chlorperbenzoësäure in 60 ml Methylenchlorid umgesetzt. Nach Reinigung des Rohprodukts mittels Flashchromatographie an Kieselgel (Laufmittel: Cyclohexan/Essigester = 1:1) erhielt man 1,7 g Wertprodukt. Ausbeute: 16 %; Fp.: 62-64°C; $^1\text{H-NMR}$ (in d^6 -Dimethylsulfoxid): δ [ppm] = 1,0 und 1,25 (2 \times d, $2\times\text{CH}_3$); 3,2 (m, CH); 8,3 und 8,5 ($2\times\text{d}, \text{Pyr-H}$).

20

In der folgenden Tabelle 2 sind weitere substituierte 2-Phenyl-pyridine I aufgeführt:

25 Tabelle 2



30

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	phys. Daten (Fp.)
1	SCH ₃	Cl	F	Cl	OH	164°C
2	SCH ₃	Cl	F	Cl	OCH ₃	102°C
3	SC ₂ H ₅	Cl	F	Cl	OCH ₃	94°C
4	SCH(CH ₃) ₂	Cl	F	Cl	OCH ₃	Öl
5	SO-CH ₃	Cl	F	Cl	OH	163°C
6	SO-CH ₃	Cl	F	Cl	OCH ₃	118°C
7	SO-CH ₃	Cl	F	Cl	OCH ₂ -C≡CH	145°C
8	SO-C ₂ H ₅	Cl	F	Cl	OCH ₃	Öl
9	SO-CH(CH ₃) ₂	Cl	F	Cl	OCH ₃	138°C
10	SO ₂ -C ₂ H ₅	Cl	F	Cl	OCH ₃	147°C
11	SO ₂ -CH(CH ₃) ₂	Cl	F	Cl	OCH ₃	120°C

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	phys. Daten (Fp.)
5	SCH ₃	Cl	H	Cl	OH	101°C
	SCH ₃	Cl	Cl	Cl	OCH ₃	115°C
	SCH ₃	Cl	H	OCH ₃	H	90°C
	SO-CH ₃	H	F	Cl	OCH ₃	137°C
	SO ₂ -CH ₃	H	F	Cl	OCH ₃	151°C
	SO ₂ -CH ₃	Cl	H	OH	H	226°C
10	SO ₂ -CH ₃	Cl	H	OH	NO ₂	182°C

Anwendungsbeispiele (herbizide Wirksamkeit)

15 Die herbizide Wirkung der substituierten 2-Phenylpyridine I ließ sich durch die folgenden Gewächshausversuche zeigen:

Als Kulturgefäße dienten Plastikblumentöpfe mit lehmigem Sand mit etwa 3,0 % Humus als Substrat. Die Samen der Testpflanzen wurden 20 nach Arten getrennt eingesät.

Bei Vorauflaufbehandlung wurden die in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffe direkt nach Einsaat mittels fein verteilender Düsen aufgebracht. Die Gefäße wurden leicht beregnet, 25 um Keimung und Wachstum zu fördern, und anschließend mit durchsichtigen Plastikhauben abgedeckt, bis die Pflanzen angewachsen waren. Diese Abdeckung bewirkt ein gleichmäßiges Keimen der Testpflanzen, sofern dies nicht durch die Wirkstoffe beeinträchtigt wurde.

30 Zum Zweck der Nachauflaufbehandlung wurden die Testpflanzen je nach Wuchsform erst bis zu einer Wuchshöhe von 3 bis 15 cm angezogen und erst dann mit den in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffen behandelt. Die Testpflanzen wurden dafür 35 entweder direkt gesät und in den gleichen Gefäßen aufgezogen oder sie wurden erst als Keimpflanzen getrennt angezogen und einige Tage vor der Behandlung in die Versuchsgefäße verpflanzt. Die Aufwandmenge für die Nachauflaufbehandlung betrug 0,0313 oder 0,0156 kg/ha a.S. (aktive Substanz).

40 Die Pflanzen wurden artenspezifisch bei Temperaturen von 10 bis 25°C bzw. 20 bis 35°C gehalten. Die Versuchsperiode erstreckte sich über 2 bis 4 Wochen. Während dieser Zeit wurden die Pflanzen gepflegt, und ihre Reaktion auf die einzelnen Behandlungen wurde 45 ausgewertet.

Bewertet wurde nach einer Skala von 0 bis 100. Dabei bedeutet 100 kein Aufgang der Pflanzen bzw. völlige Zerstörung zumindest der oberirdischen Teile und 0 keine Schädigung oder normaler Wachstumsverlauf.

5

Die in den Gewächshausversuchen verwendeten Pflanzen setzten sich aus folgenden Arten zusammen:

	Lateinischer Name	Deutscher Name	Englischer Name
10	Abutilon theophrasti	Chinesischer Hanf	velvet leaf
	Chenopodium album	Weißen Gänsefuß	lambsquarters (goosefoot)
	Solanum nigrum	Schwarzer Nachtschatten	black nightshade
	Veronica species	Ehrenpreisarten	speedwell

15

Bei Aufwandmengen von 0,0313 und 0,0156 kg/ha a.S. zeigte die Verbindung Nr. Ia.384 im Nachlaufverfahren eine sehr gute herbizide Wirkung gegen die obengenannten breitblättrigen Pflanzen.

20

Anwendungsbeispiele (desikkative/defoliante Wirksamkeit)

Als Testpflanzen dienten junge, 4blättrige (ohne Keimblätter) Baumwollpflanzen, die unter Gewächshausbedingungen angezogen

25 wurden (rel. Luftfeuchtigkeit 50 bis 70 %; Tag-/Nachttemperatur 27/20°C).

Die jungen Baumwollpflanzen wurden tropfnaß mit wässrigen Aufbereitungen der Wirkstoffe (unter Zusatz von 0,15 Gew.-% des 30 Fettalkoholalkoxylats Plurafac® LF 700²⁾, bezogen auf die Spritzbrühe) blattbehandelt. Die ausgebrachte Wassermenge betrug umgerechnet 1000 l/ha. Nach 13 Tagen wurde die Anzahl der abgeworfenen Blätter und der Grad der Entblätterung in % bestimmt.

35 Bei den unbehandelten Kontrollpflanzen trat kein Blattfall auf.

40

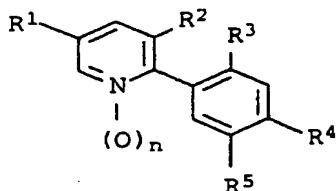
45

²⁾ ein schaumarmes, nichtionisches Tensid der BASF AG

Patentansprüche

1. Substituierte 2-Phenylpyridine der allgemeinen Formel I

5



I,

10

in der die Variablen folgende Bedeutungen haben:

n Null oder 1;

15

R¹ Mercapto, Hydroxysulfonyl, Chlorsulfonyl, Amino-sulfonyl, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Alkylaminosulfonyl oder Di-(C₁-C₆-alkyl)aminosulfonyl;

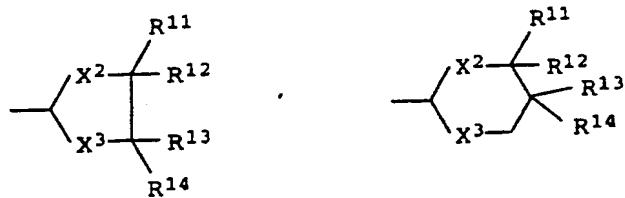
20

R², R³ unabhängig voneinander Wasserstoff oder Halogen;R⁴ Cyano, Hydroxy, Halogen, C₁-C₆-Alkoxy oder Phenyl-methoxy, wobei der Phenytring unsubstituiert sein oder ein bis drei Substituenten tragen kann, jeweils ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Hydroxy, Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Hydroxycarbonyl, (C₁-C₆-Alkoxy)-carbonyl und (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₆-alkoxy;

25

R⁵ Wasserstoff, Nitro, Cyano, Hydroxylamino, Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, -COCl, -CO-OR⁶, -CO-N(R⁷)R⁸, -CO-O-(C₁-C₄-Alkylen)-CO-OR⁶, -CO-O-(C₁-C₄-Alkylen)-CO-N(R⁷)R⁸, -X¹-(C₁-C₄-Alkylen)-CO-R⁶, -X¹-(C₁-C₄-Alkylen)-CO-O-(C₁-C₄-Alkylen)-CO-OR⁶, -X¹-(C₁-C₄-Alkylen)-CO-N(R⁷)R⁸, -X¹-R⁹, -CH=C(R¹⁰)-CO-OR⁶, -CH=C(R¹⁰)-CO-O-(C₁-C₄-Alkylen)-CO-OR⁶, -CH=C(R¹⁰)-CO-N(R⁷)R⁸, Formyl, -CO-R⁶,

30



35

-C(R⁸)=N-OR¹⁵, -X¹-(C₁-C₄-Alkylen)-C(R⁸)=N-OR¹⁵,
 -CH=C(R¹⁰)-C(R⁸)=N-OR¹⁵, -CH(C₁-C₆-Alkoxy)₂, -N(R¹⁶)R¹⁷,
 -N(R¹⁶)-SO₂-(C₁-C₆-Alkyl), -N(R¹⁶)-CO-(C₁-C₆-Alkyl),
 Chlorsulfonyl, Hydroxysulfonyl oder -SO₂-N(R¹⁸)R¹⁹;

5

R⁶ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl,
 C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkinyl, C₃-C₆-Cycloalkyl,
 C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl oder 3-Oxetanyl;

10 R⁷ Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl;

R⁸ Wasserstoff, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, Hydroxycarbo-
 nyl-C₁-C₆-alkyl, (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₆-alkyl,
 C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Phenyl-C₁-C₆-alkoxy,
 15 C₃-C₆-Alkenyloxy oder C₃-C₆-Alkinyloxy oder

R⁷ und R⁸ zusammen eine Tetra- oder Pentamethylenkette,
 die einen (C₁-C₆-Alkoxy)carbonylrest tragen kann;

20 R⁹ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl,
 C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkinyl, C₃-C₆-Cycloalkyl
 oder C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl;R¹⁰ Wasserstoff, Halogen oder C₁-C₆-Alkyl;25 R¹¹-R¹⁴ unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl
 oder (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl;

R¹⁵ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, Phenyl-C₁-C₆-alkyl,
 30 (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₆-alkyl, C₃-C₆-Alkenyl
 oder C₃-C₆-Alkinyl;

R¹⁶ Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl;

35 R¹⁷ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, Hydroxycarbonyl-C₁-C₆-alkyl,
 (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₆-alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy;

R¹⁸ Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl;

40 R¹⁹ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, Hydroxycarbonyl-C₁-C₆-alkyl,
 (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₆-alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy
 oder

R¹⁸ und R¹⁹ zusammen eine Tetra- oder Pentamethylenkette,
 45 die einen (C₁-C₆-Alkoxy)carbonylrest tragen kann;

X¹-X³ unabhängig voneinander Sauerstoff oder Schwefel,

55

sowie die landwirtschaftlich brauchbaren Salze der Verbindungen I mit R⁶ = Wasserstoff.

2. Substituierte 2-Phenylpyridine der Formel I und deren Salze,
5 nach Anspruch 1, wobei

R⁵ für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Hydroxylamino,
C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, -COCl, -CO-OR⁶,
-CO-O-(C₁-C₄-Alkylen)-CO-OR⁶, -O-(C₁-C₄-Alkylen)-CO-OR⁶,
10 -O-(C₁-C₄-Alkylen)-CO-O-(C₁-C₄-Alkylen)-CO-OR⁶, -OR⁹,
Formyl, -CH=N-OR¹⁵ oder -NH₂;

R⁶ für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkinyl
15 oder C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl;

R⁹ für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl oder
C₃-C₆-Alkinyl und

R¹⁵ für C₁-C₆-Alkyl stehen.

20 3. Verwendung der substituierten 2-Phenylpyridine der Formel I und der landwirtschaftlich brauchbaren Salze von I, gemäß Anspruch 1, als Herbizide oder zur Desikkation und/oder Defoliation von Pflanzen.

25 4. Herbizides Mittel, enthaltend eine herbizid wirksame Menge mindestens eines substituierten 2-Phenylpyridins der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I, gemäß Anspruch 1, und mindestens einen inerten flüssigen und/oder festen Trägerstoff sowie gewünschtenfalls mindestens einen oberflächenaktiven Stoff.

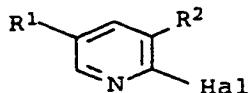
30 5. Mittel zur Desikkation und/oder Defoliation von Pflanzen, enthaltend eine desikkant und/oder defoliant wirksame Menge mindestens eines substituierten 2-Phenylpyridins der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I, gemäß Anspruch 1, und mindestens einen inerten flüssigen und/oder festen Trägerstoff sowie gewünschtenfalls mindestens einen oberflächenaktiven Stoff.

35 6. Verfahren zur Herstellung von herbizid wirksamen Mitteln, dadurch gekennzeichnet, daß man eine herbizid wirksame Menge mindestens eines substituierten 2-Phenylpyridins der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I, gemäß Anspruch 1, und mindestens einen inerten flüssigen und/oder festen Trägerstoff sowie gewünschtenfalls mindestens einen oberflächenaktiven Stoff mischt.

7. Verfahren zur Herstellung von desikkant und/oder defoliant wirksamen Mitteln, dadurch gekennzeichnet, daß man eine desikkant und/oder defoliant wirksame Menge mindestens eines substituierten 2-Phenylpyridins der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I, gemäß Anspruch 1, und mindestens einen inerten flüssigen und/oder festen Trägerstoff sowie gewünschtenfalls mindestens einen oberflächenaktiven Stoff mischt.
- 10 8. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs, dadurch gekennzeichnet, daß man eine herbizid wirksame Menge mindestens eines substituierten 2-Phenylpyridins der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I, gemäß Anspruch 1, auf Pflanzen, deren Lebensraum oder auf Saatgut einwirken läßt.
9. Verfahren zur Desikkation und/oder Defoliation von Pflanzen, dadurch gekennzeichnet, daß man eine desikkant und/oder defoliant wirksame Menge mindestens eines substituierten 2-Phenylpyridins der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I, gemäß Anspruch 1, auf Pflanzen einwirken läßt.
10. Verfahren nach Anspruch 9, dadurch gekennzeichnet, daß man Baumwolle behandelt.
11. Verfahren zur Herstellung von substituierten 2-Phenylpyridinen der Formel I gemäß Anspruch 1, bei denen n für 1 steht und R¹ und R⁵ keinen oxidierbaren Schwefel enthalten, dadurch gekennzeichnet, daß man die entsprechenden substituierten 2-Phenylpyridine, bei denen aber n Null bedeutet, in einem inerten Lösungs-/Verdünnungsmittel oxidiert.
12. Verfahren zur Herstellung von substituierten 2-Phenylpyridinen der Formel I gemäß Anspruch 1, bei denen R¹ für C₁-C₆-Alkylsulfinyl oder C₁-C₆-Alkylsulfonyl steht und der Substituent R⁵ keinen oxidierbaren Schwefel enthält, dadurch gekennzeichnet, daß man die entsprechenden substituierten 2-Phenylpyridine, bei denen aber R¹ C₁-C₆-Alkylthio oder C₁-C₆-Alkylsulfinyl bedeutet, in einem inerten Lösungs-/Verdünnungsmittel oxidiert.

13. Verfahren zur Herstellung von substituierten 2-Phenylpyridinen der Formel I gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man ein 2-Halogenpyridin der Formel II

5

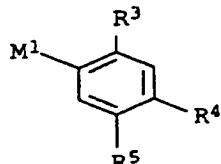


II.

10

wobei Hal für Chlor oder Brom steht, in Gegenwart eines Übergangsmetallkatalysators mit einer metallorganischen Verbindung der Formel III

15

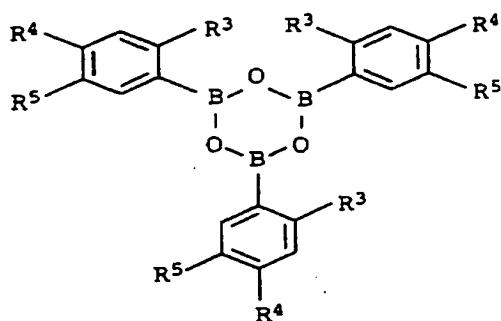


III.

20

wobei M1 für $B(OH)_2$, $Mg\cdot Cl$, $Mg\cdot Br$, $Mg\cdot J$, $Zn\cdot Cl$, $Zn\cdot Br$, $Zn\cdot J$, Lithium, Kupfer oder Zinntri($C_1\text{-}C_4$ -alkyl) steht, oder mit einem Boroxin der Formel IV

25



IV

30

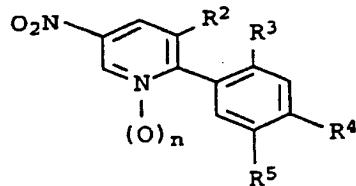
umsetzt.

14. Verfahren nach Anspruch 13, dadurch gekennzeichnet, daß man II mit einer metallorganischen Verbindung der Formel III umsetzt, wobei M1 für $B(OH)_2$, $Mg\cdot Cl$, $Mg\cdot Br$, $Mg\cdot J$, $Zn\cdot Cl$, $Zn\cdot Br$ oder $Zn\cdot J$ steht.

35

15. Verfahren zur Herstellung von substituierten 2-Phenylpyridinen der Formel I gemäß Anspruch 1, bei denen R¹ für $C_1\text{-}C_6$ -Alkylthio steht, dadurch gekennzeichnet, daß man 5-Nitro-2-phenylpyridine der Formel V

40

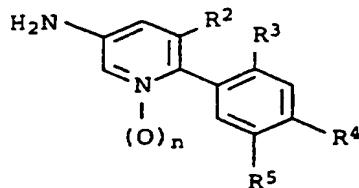


V.

45

wobei n und R² bis R⁵ die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,
reduziert, die hierbei erhaltenen 5-Amino-2-phenylpyridine
der Formel VI

5



10

diazotiert und die Diazoniumsalze schließlich mit symmetrischen aliphatischen Disulfiden der Formel VII



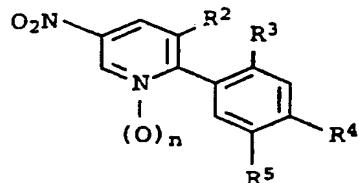
VII

15

umsetzt.

16. 15-Nitro-2-phenylpyridine der Formel V

20



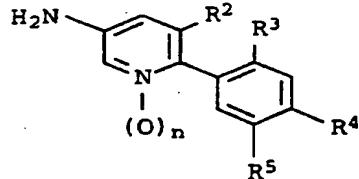
25

wobei n für 0 oder 1 steht und die Substituenten R² bis R⁵
die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,
ausgenommen 2-(4-Chlor-3-methoxyphenyl)-5-nitropyridin und
2-(4-Chlor-3-methoxyphenyl)-3-chlor-5-nitropyridin.

30

17. 5-Amino-2-phenylpyridine der Formel VI

35

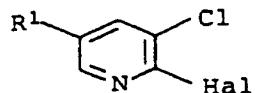


40

wobei n für 0 oder 1 steht und die Substituenten R² bis R⁵
die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,
ausgenommen 5-Amino-2-(4-chlor-3-methoxyphenyl)-pyridin und
5-Amino-2-(4-chlor-3-methoxyphenyl)-3-chlorpyridin.

45

18. 2-Halogenpyridine der Formel IIa



IIa,

5

wobei Hal für Chlor oder Brom steht und R¹ die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung hat.

10

15

20

25

30

35

40

45

60

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/NL 97/04420A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 6 C07D213/70 C07D213/71 A01N43/40 C07D213/61 C07D213/73

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 6 C07D

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	DE 43 23 916 A (BASF AG) 19 January 1995 see the whole document & WO 95 02580 A cited in the application	1-18
X	DE 195 00 911 A (BASF AG) 18 July 1996 cited in the application see the whole document	1-10
X	WO 94 10118 A (CELLTECH LTD) 11 May 1994 see example 31	16

 Further documents are listed in the continuation of box C. Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents :

- *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- *E* earlier document but published on or after the international filing date
- *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- *&* document member of the same patent family

1

Date of the actual completion of the international search	Date of mailing of the international search report
3 December 1997	23/12/1997
Name and mailing address of the ISA European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl. Fax: (+31-70) 340-3016	Authorized officer Bosma, P

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP 97/04420

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	Y. TOHDA ET AL.: "Nucleophilic reaction upon electron-deficient pyridone derivatives. X. One-pot synthesis of 3-nitropyridines by ring transformation of 1-methyl-3,5-dinitro-2-pyridone with ketones or aldehydes in the presence of ammonia." BULLETIN OF THE CHEMICAL SOCIETY OF JAPAN., vol. 63, no. 10, 1990, TOKYO JP, pages 2820-2827, XP002048928 see compound 6m	16
X	US 4 405 552 A (MIESEL JOHN L) 20 September 1983 see example 52	17
X	DE 22 29 611 A (BOEHRINGER MANNHEIM GMBH) 10 January 1974 see page 15, line 8	17
X	G.L. WALFORD ET AL.: "Aza analogs of 5-(p-fluorophenyl)salicylic acid" JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY., vol. 14, no. 4, 1971, WASHINGTON US, pages 339-344, XP002048929 see compound 12	17
X	EP 0 147 105 A (EASTMAN KODAK CO ;KODAK LTD (GB)) 3 July 1985 see page 36, line 25 - page 37, line 5	18

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/... 97/04420

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
DE 4323916 A	19-01-95	AU 680676 B AU 7385394 A AU 678594 B AU 7492294 A BR 9407038 A BR 9407039 A CA 2167290 A CA 2167291 A CN 1127504 A CN 1127507 A CZ 9600021 A CZ 9600125 A WO 9502580 A WO 9502590 A EP 0708756 A EP 0708769 A FI 960181 A FI 960182 A HU 73735 A HU 73728 A JP 9503747 T JP 9503748 T MX 9405417 A NO 960171 A NO 960172 A NZ 269555 A PL 312610 A PL 312611 A ZA 9405170 A ZA 9405171 A	07-08-97 13-02-95 05-06-97 13-02-95 12-03-96 12-03-96 26-01-95 26-01-95 24-07-96 24-07-96 17-04-96 15-05-96 26-01-95 26-01-95 01-05-96 01-05-96 15-01-96 15-01-96 30-09-96 30-09-96 15-04-97 15-04-97 31-01-95 09-02-96 29-02-96 24-04-97 29-04-96 29-04-96 15-01-96 15-01-96
DE 19500911 A	18-07-96	AU 4436696 A WO 9621646 A EP 0802903 A	31-07-96 18-07-96 29-10-97
WO 9410118 A	11-05-94	AU 675466 B AU 5340894 A CA 2126072 A EP 0618889 A JP 7502762 T	06-02-97 24-05-94 11-05-94 12-10-94 23-03-95

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No
PCT/EP 97/04420

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9410118 A		NZ 257155 A US 5491147 A US 5674880 A	26-05-97 13-02-96 07-10-97
US 4405552 A	20-09-83	US 4508722 A AR 229048 A AU 8097682 A BR 8201054 A CS 227040 B DK 90582 A EP 0060071 A GB 2093844 A JP 57158759 A OA 7032 A	02-04-85 31-05-83 09-09-82 11-01-83 16-04-84 04-09-82 15-09-82 08-09-82 30-09-82 31-12-83
DE 2229611 A	10-01-74	AR 193771 A AT 319478 B AU 463917 B AU 5019072 A CA 959390 A CH 578735 A DD 103732 A DK 143239 B FR 2190278 A GB 1382187 A JP 1138583 C JP 49044797 A JP 57027423 B NL 7216892 A SE 408233 C SE 408233 B US 3850576 A ZA 7208786 A	22-05-73 27-12-74 24-07-75 20-06-74 17-12-74 13-08-76 05-02-74 27-07-81 25-01-74 29-01-75 11-03-83 27-04-74 10-06-82 21-12-73 30-08-79 21-05-79 26-11-74 26-09-73
EP 0147105 A	03-07-85	DE 3471179 A JP 60158443 A US 4548888 A	16-06-88 19-08-85 22-10-85

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP 97/04420

A. KLASIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
IPK 6 C07D213/70 C07D213/71 A01N43/40 C07D213/61 C07D213/73

Nach der internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)
IPK 6 C07D

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	DE 43 23 916 A (BASF AG) 19.Januar 1995 siehe das ganze Dokument & WO 95 02580 A in der Anmeldung erwähnt ---	1-18
X	DE 195 00 917 A (BASF AG) 18.Juli 1996 in der Anmeldung erwähnt siehe das ganze Dokument ---	1-10
X	WO 94 10118 A (CELLTECH LTD) 11.Mai 1994 siehe Beispiel 3i ---	16 -/-

Weitere Veröffentlichungen, sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen

A Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

E älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

L Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

O Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

P Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

T Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht konfliktieren, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

X Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfindenderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

Y Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfindenderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

& Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

1

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche	Absendedatum des internationalen Recherchenberichts
3.Dezember 1997	23/12/1997
Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2290 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl. Fax: (+31-70) 340-3016	Bevollmächtigter Bediensteter Bosma, P

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PC1/EP 97/04420

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		Betr. Anspruch Nr.
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	
X	Y. TOHDA ET AL.: "Nucleophilic reaction upon electron-deficient pyridone derivatives. X. One-pot synthesis of 3-nitropyridines by ring transformation of 1-methyl-3,5-dinitro-2-pyridone with ketones or aldehydes in the presence of ammonia." BULLETIN OF THE CHEMICAL SOCIETY OF JAPAN., Bd. 63, Nr. 10, 1990, TOKYO JP, Seiten 2820-2827, XP002048928 siehe Verbindung 6m ---	16
X	US 4 405 552 A (MIESEL JOHN L) 20.September 1983 siehe Beispiel 52 ---	17
X	DE 22 29 611 A (BOEHRINGER MANNHEIM GMBH) 10.Januar 1974 siehe Seite 15, Zeile 8 ---	17
X	G.L. WALFORD ET AL.: "Aza analogs of 5-(p-fluorophenyl)salicylic acid" JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY., Bd. 14, Nr. 4, 1971, WASHINGTON US, Seiten 339-344, XP002048929 siehe Verbindung 12 ----	17
X	EP 0 147 105 A (EASTMAN KODAK CO ;KODAK LTD (GB)) 3.Juli 1985 siehe Seite 36, Zeile 25 - Seite 37, Zeile 5 -----	18

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT EP 97/04420

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglieder der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
DE 4323916 A	19-01-95	AU 680676 B AU 7385394 A AU 678594 B AU 7492294 A BR 9407038 A BR 9407039 A CA 2167290 A CA 2167291 A CN 1127504 A CN 1127507 A CZ 9600021 A CZ 9600125 A WO 9502580 A WO 9502590 A EP 0708756 A EP 0708769 A FI 960181 A FI 960182 A HU 73735 A HU 73728 A JP 9503747 T JP 9503748 T MX 9405417 A NO 960171 A NO 960172 A NZ 269555 A PL 312610 A PL 312611 A ZA 9405170 A ZA 9405171 A	07-08-97 13-02-95 05-06-97 13-02-95 12-03-96 12-03-96 26-01-95 26-01-95 24-07-96 24-07-96 17-04-96 15-05-96 26-01-95 26-01-95 01-05-96 01-05-96 15-01-96 15-01-96 30-09-96 30-09-96 15-04-97 15-04-97 31-01-95 09-02-96 29-02-96 24-04-97 29-04-96 29-04-96 15-01-96 15-01-96
DE 19500911 A	18-07-96	AU 4436696 A WO 9621646 A EP 0802903 A	31-07-96 18-07-96 29-10-97
WO 9410118 A	11-05-94	AU 675466 B AU 5340894 A CA 2126072 A EP 0618889 A JP 7502762 T	06-02-97 24-05-94 11-05-94 12-10-94 23-03-95

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Interne Aktenzeichen

PCT/EP 97/04420

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglieder der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 9410118 A		NZ 257155 A US 5491147 A US 5674880 A	26-05-97 13-02-96 07-10-97
US 4405552 A	20-09-83	US 4508722 A AR 229048 A AU 8097682 A BR 8201054 A CS 227040 B DK 90582 A EP 0060071 A GB 2093844 A JP 57158759 A OA 7032 A	02-04-85 31-05-83 09-09-82 11-01-83 16-04-84 04-09-82 15-09-82 08-09-82 30-09-82 31-12-83
DE 2229611 A	10-01-74	AR 193771 A AT 319478 B AU 463917 B AU 5019072 A CA 959390 A CH 578735 A DD 103732 A DK 143239 B FR 2190278 A GB 1382187 A JP 1138583 C JP 49044797 A JP 57027423 B NL 7216892 A SE 408233 C SE 408233 B US 3850576 A ZA 7208786 A	22-05-73 27-12-74 24-07-75 20-06-74 17-12-74 13-08-76 05-02-74 27-07-81 25-01-74 29-01-75 11-03-83 27-04-74 10-06-82 21-12-73 30-08-79 21-05-79 26-11-74 26-09-73
EP 0147105 A	03-07-85	DE 3471179 A JP 60158443 A US 4548888 A	16-06-88 19-08-85 22-10-85

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- BLACK BORDERS**
- IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**
- FADED TEXT OR DRAWING**
- BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING**
- SKEWED/SLANTED IMAGES**
- COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS**
- GRAY SCALE DOCUMENTS**
- LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT**
- REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY**
- OTHER:** _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.

THIS PAGE BLANK (USPTO)